

(19) 日本国特許庁 (J P)

(12) 公開特許公報 (A)

(11) 特許出願公開番号

特開平11-60562

(43) 公開日 平成11年(1999) 3月2日

(51) Int.Cl. ⁵	識別記号	F I
C 0 7 D 239/52		C 0 7 D 239/52
A 0 1 N 43/54		A 0 1 N 43/54
43/60		43/60
43/84	1 0 1	43/84
C 0 7 D 239/60		C 0 7 D 239/60
		1 0 1

審査請求 未請求 請求項の数 3 F D (全 57 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号	特願平10-173980	(71) 出願人	000000169 クミアイ化学工業株式会社 東京都台東区池之端 1 丁目 4 番 26 号
(22) 出願日	平成10年(1998) 6月5日	(71) 出願人	000102049 イハラケミカル工業株式会社 東京都台東区池之端 1 丁目 4 番 26 号
(31) 優先権主張番号	特願平9-169454	(72) 発明者	吉村 巧 静岡県磐田郡福田町塩新田408番地の1 株式会社ケイ・アイ研究所内
(32) 優先日	平9(1997) 6月11日	(72) 発明者	宮崎 雅弘 静岡県磐田郡福田町塩新田408番地の1 株式会社ケイ・アイ研究所内
(33) 優先権主張国	日本 (J P)		

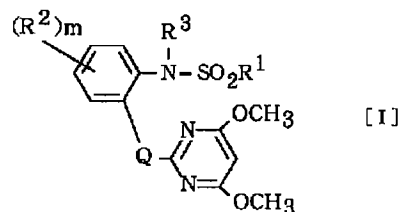
最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 スルホンアニリド誘導体及び除草剤

(57) 【要約】

【課題】 水田における有害雑草に対して優れた除草効果を有するとともに作物に安全性が高いスルホンアニリド誘導体を提供する。

【解決手段】 一般式 [I]



{式中、R¹ はアルキル基又はアルケニル基〔該基はいずれもハロゲン原子等で置換されてもよい。〕を示し、R² は水素原子、ハロゲン原子又はアルコキシ基等を示し、R³ は水素原子、アルキル基又はアルコキシカルボニル基等を示し、Qは基-CH(NR⁴ R⁵)-〔ここでR⁴、R⁵ は水素原子、アルキル基等を示す。〕又は基-C(=NR⁶)-〔ここでR⁶ は水素原子、アルキル基等を示す。〕を示し、mは1~4の整数を示す。}

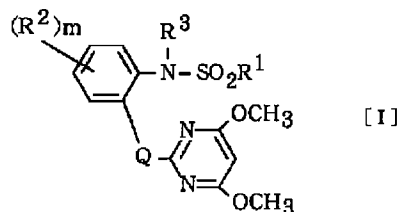
で示されるスルホンアニリド誘導体及びその塩、該スル

ホンアニリド誘導体を有効成分として含有する除草剤。

【特許請求の範囲】

【請求項1】 一般式【I】

【化1】

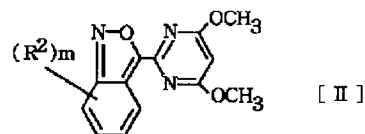


〔式中、 R^1 はアルキル基（該基はハロゲン原子又はシアノ基で置換されてもよい。）又はアルケニル基（該基はハロゲン原子で置換されてもよい。）を示し、 R^2 は各々独立して、水素原子、ハロゲン原子、アルコキシ基又はアルキル基（該基はハロゲン原子、水酸基、アルコキシ基、アルケニルオキシ基、アルキニルオキシ基、アルキルチオ基、モノ又はジアルキルアミノ基で置換されてもよい。）を示し、 R^3 は水素原子、アルキル基（該基はハロゲン原子、水酸基、アルケニルオキシ基、アルキニルオキシ基、モノ又はジアルキルアミノ基、アルコキシ基又はアルキルチオ基で置換されてもよい。））、ベンジル基、アシル基、アルコキシカルボニル基、置換されたカルバモイル基、置換されたチオカルバモイル基又は基- SO_2R^1 （ここで R^1 は前記と同じ意味を示す。）を示し、 Q は基- $CH(NR^4R^5)-$ 〔ここで R^4 、 R^5 は同一か又は相異なり、水素原子、アルキル基（該基はハロゲン原子、水酸基、シアノ基、アルコキシ基、アルキルチオ基又はフェニル基で置換されてもよい。））、アルケニル基、アルキニル基、シクロアルキル基、フェニル基（該基はハロゲン原子、アルキル基又はアルコキシ基で置換されてもよい。））、アシル基、アルコキシカルボニル基、置換されたカルバモイル基、置換されたチオカルバモイル基、基- SO_2R^1 （ここで R^1 は前記と同じ意味を示す。））、基- NR^7R^8 〔ここで R^7 、 R^8 は同一か又は相異なり、水素原子、アルキル基（該基はハロゲン原子、水酸基、シアノ基、アルコキシ基、アルキルチオ基又はフェニル基で置換されてもよい。））、アルケニル基、アルキニル基、シクロアルキル基、フェニル基（該基はハロゲン原子、アルキル基又はアルコキシ基で置換されてもよい。））、アシル基、アルコキシカルボニル基、置換されたカルバモイル基、置換されたチオカルバモイル基、基- SO_2R^1 （ここで R^1 は前記と同じ意味を示す。））、置換されたカルバモイル基又は置換されたチオカルバモイル基を示す。〕又は基- OR^9 〔ここで R^9 は水素原子、アルキル基（該基はハロゲン原子、水酸基、シアノ基、アルコキシ基、アルキルチオ基、フェニル基で置換されてもよい。））、アルケニル基、アルキニル基、シクロアルキル基、フェニル基（該基はハロゲン原子、アルキル基又はアルコキシ基で置換されてもよい。））、アシル基、アルコキシカルボニル基、アルキルスルホニル基（該基はハロゲン原子で置換されてもよい。））、置換されたカルバモイル基又は置換

されたチオカルバモイル基を示す。〕を示し、或いは場合により、 R^4 及び R^5 はこれらの結合した窒素原子と合わせて一つ又はそれ以上のヘテロ原子を有する含窒素ヘテロ環基を形成してもよい。〕又は基- $C(=NR^6)-$ 〔ここで R^6 は水素原子、アルキル基（該基はハロゲン原子、水酸基、シアノ基、アルコキシ基、アルキルチオ基、フェニル基で置換されてもよい。））、アルケニル基、アルキニル基、シクロアルキル基、フェニル基（該基はハロゲン原子、アルキル基、アルコキシ基で置換されてもよい。））、アシル基、アルコキシカルボニル基、置換されたカルバモイル基、置換されたチオカルバモイル基、基- SO_2R^1 （ここで R^1 は前記と同じ意味を示す。））、基- NR^7R^8 （ここで R^7 及び R^8 は前記と同じ意味を示す。）又は基- OR^9 （ここで R^9 は前記と同じ意味を示す。）を示す。〕を示し、 m は1～4の整数を示す。〕で示されるスルホンアニリド誘導体及びその塩。

【請求項2】 一般式【II】

【化2】



〔式中、 R^2 及び m は請求項1に記載と同じ意味を示す。〕で示される請求項1に記載のスルホンアニリド誘導体の製造中間体である4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル誘導体。

【請求項3】 請求項1に記載のスルホンアニリド誘導体又はその塩を有効成分として含有することを特徴とする除草剤。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【産業上の利用分野】 本発明は新規なスルホンアニリド誘導体およびそれを有効成分として含有することを特徴とする除草剤に関するものである。

【0002】

【従来技術】 特表平7-501053号公報明細書及びWO96/41799号公報明細書にはアニリドの2'位にピリミジン-2-イル基が置換したスルホンアニリド化合物が除草活性を有することが記載されている。

【0003】 しかしながら、該公報明細書には、アニリドの2'位へのピリミジン-2-イル基の置換において、ピリミジン2位とアニリド2'位との結合が、メチレン基、ハロゲン置換メチレン基、カルボニル基、ヒドロキシ基、オキソメチレン基、アルコキシ基、チオキソメチレン基又はアルキルチオ基である化合物及びそれらの誘導体が記載されているものの、本発明スルホンアニリド誘導体のように、ピリミジン2位とアニリドの2'位との結合にアミノメチレン基、イミノメチレン基

を有する化合物については知られていない。即ち、本発明スルホンアニリド誘導体およびそれを有効成分とする除草剤について具体的な除草効果や製造法は今まで知られていない。更に特表平7-501053号公報明細書及びWO96/41799号公報明細書に記載の化合物は除草活性が不十分であったり、作物と雑草間の選択性に劣ることから満足すべきものとは言い難い。

【0004】

【発明が解決しようとする課題】現在、水田においてはカヤツリグサ科雑草等、種々の難防除雑草が問題になっている。これらの雑草は発生が不揃いで、しかも水稻の栽培時期に長期間に渡って発生してくるため、その防除は難しい課題となっている。このため、それらを防除できる処理適期幅の広い薬剤の開発が望まれている。また、現在的水稻除草剤では、葉齢の小さい水稻や移植深度の浅い水稻に対しても安全に除草剤を使用することは、極めて難しい課題となっている。特に水稻に対し高い安全性を有する除草剤の出現は、移植時に除草剤の同時処理を可能にし、稲作作業の合理化、大型化にとって大いに切望されている。

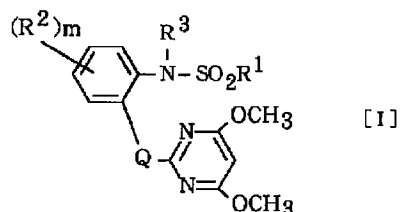
【0005】

【課題を解決するための手段】本発明者らは、このような状況に鑑み種々検討した結果、新規なスルホンアニリド誘導体とその製造方法を案出し、該化合物が上述のような欠点の少ない優れた除草作用を有することを見出し、本発明を完成するに至った。

【0006】即ち、本発明は(1)一般式[I]

【0007】

【化3】

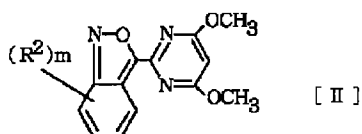


(式中、 R^1 はアルキル基(該基はハロゲン原子又はシアノ基で置換されてもよい。))又はアルケニル基(該基はハロゲン原子で置換されてもよい。)を示し、 R^2 は各々独立して、水素原子、ハロゲン原子、アルコキシ基又はアルキル基(該基はハロゲン原子、水酸基、アルコキシ基、アルケニルオキシ基、アルキニルオキシ基、アルキルチオ基、モノ又はジアルキルアミノ基で置換されてもよい。)を示し、 R^3 は水素原子、アルキル基(該基はハロゲン原子、水酸基、アルケニルオキシ基、アルキニルオキシ基、モノ又はジアルキルアミノ基、アルコキシ基又はアルキルチオ基で置換されてもよい。)、ベンジル基、アシル基、アルコキシカルボニル基、置換されたカルバモイル基、置換されたチオカルバモイル基又は基- SO_2R^1 (ここで R^1 は前記と同じ意味を示す。)を示し、 Q は基- $CH(NR^4R^5)-$ [ここで

R^4 、 R^5 は同一か又は相異なり、水素原子、アルキル基(該基はハロゲン原子、水酸基、シアノ基、アルコキシ基、アルキルチオ基又はフェニル基で置換されてもよい。)、アルケニル基、アルキニル基、シクロアルキル基、フェニル基(該基はハロゲン原子、アルキル基又はアルコキシ基で置換されてもよい。)、アシル基、アルコキシカルボニル基、置換されたカルバモイル基、置換されたチオカルバモイル基、基- SO_2R^1 (ここで R^1 は前記と同じ意味を示す。)、基- NR^7R^8 [ここで R^7 、 R^8 は同一か又は相異なり、水素原子、アルキル基(該基はハロゲン原子、水酸基、シアノ基、アルコキシ基、アルキルチオ基又はフェニル基で置換されてもよい。)、アルケニル基、アルキニル基、シクロアルキル基、フェニル基(該基はハロゲン原子、アルキル基又はアルコキシ基で置換されてもよい。)、アシル基、アルコキシカルボニル基、基- SO_2R^1 (ここで R^1 は前記と同じ意味を示す。)、置換されたカルバモイル基又は置換されたチオカルバモイル基を示す。]又は基- OR^9 [ここで R^9 は水素原子、アルキル基(該基はハロゲン原子、水酸基、シアノ基、アルコキシ基、アルキルチオ基、フェニル基で置換されてもよい。)、アルケニル基、アルキニル基、シクロアルキル基、フェニル基(該基はハロゲン原子、アルキル基、アルコキシ基で置換されてもよい。)、アシル基、アルコキシカルボニル基、アルキルスルホニル基(該基はハロゲン原子で置換されてもよい。)、置換されたカルバモイル基又は置換されたチオカルバモイル基を示す。]を示し、或いは場合により、 R^4 及び R^5 はこれらの結合した窒素原子と合わせて一つ又はそれ以上のヘテロ原子を有する含窒素ヘテロ環基を形成してもよい。]又は基- $C(=NR^6)-$ [ここで R^6 は水素原子、アルキル基(該基はハロゲン原子、水酸基、シアノ基、アルコキシ基、アルキルチオ基、フェニル基で置換されてもよい。)、アルケニル基、アルキニル基、シクロアルキル基、フェニル基(該基はハロゲン原子、アルキル基、アルコキシ基で置換されてもよい。)、アシル基、アルコキシカルボニル基、置換されたカルバモイル基、置換されたチオカルバモイル基、基- SO_2R^1 (ここで R^1 は前記と同じ意味を示す。)、基- NR^7R^8 (ここで R^7 及び R^8 は前記と同じ意味を示す。))又は基- OR^9 (ここで R^9 は前記と同じ意味を示す。)を示す。]で示されるスルホンアニリド誘導体及びその塩、(2)一般式[I]で示される化合物の製造中間体となる一般式[II]

【0008】

【化4】



{式中、 R^2 及び m は前記と同じ意味を示す。} で示される 4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル誘導体及び、(3)一般式 [I] 記載のスルホンアニリド誘導体又はその塩を有効成分とする除草剤を提供するものである。

【0009】尚、本明細書において、用いられる用語の定義を以下に示す。

【0010】ハロゲン原子とは、フッ素原子、塩素原子、臭素原子、ヨウ素原子を示す。

【0011】アルキル基とは、特に限定しない限り、炭素数が1~10の直鎖又は分岐鎖状のアルキル基を意味し、例えばメチル基、エチル基、*n*-プロピル基、イソプロピル基、*n*-ブチル基、イソブチル基、*sec*-ブチル基、*tert*-ブチル基、*n*-ペンチル基、イソアミル基、ネオペンチル基、*n*-ヘキシル基、イソヘキシル基、3, 3-ジメチルブチル基、*n*-ヘプチル基、*n*-オクチル基、*n*-ノニル基、*n*-デシル基等を挙げることができる。

【0012】アシル基とは、ホルミル基、ベンゾイル基又はアルキル部分が上記の意味を示す(アルキル)-C(=O)-基を示し、例えばアセチル基、プロピオニル基等を挙げることができる。

【0013】アルコキシ基とは、アルキル部分が上記の意味を示す(アルキル)-O-基を示し、例えばメトキシ基、エトキシ基、*n*-プロポキシ基、イソプロポキシ基、*n*-ブトキシ基、イソブトキシ基、*sec*-ブトキシ基、*tert*-ブトキシ基、*n*-ヘキシルオキシ基、*n*-オクチルオキシ基等を挙げることができる。

【0014】アルコキシカルボニル基とは、アルコキシ部分が上記の意味を示す(アルコキシ)-C(=O)-基を示し、例えばメトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基等を挙げることができる。

【0015】アルケニル基とは、炭素数が2~6の直鎖又は分岐鎖状のアルケニル基を示し、例えばビニル基、プロペニル基等を挙げることができる。

【0016】アルケニルオキシ基とは、アルケニル部分が上記の意味を示す(アルケニル)-O-基を示し、例えばアリルオキシ基等を挙げることができる。

【0017】アルキニル基とは、炭素数が2~6の直鎖又は分岐鎖状のアルキニル基を示し、例えばプロパルギル基等を挙げることができる。

【0018】アルキニルオキシ基とは、アルキニル部分が上記の意味を示す(アルキニル)-O-基を示し、例えばプロパルギルオキシ基等を挙げることができる。

【0019】シクロアルキル基とは、炭素数3~7のシ

クロアルキル基を示し、例えばシクロプロピル基、シクロペンチル基等を挙げることができる。

【0020】アルキルチオ基及びアルキルスルホニル基とは、アルキル部分が上記の意味である(アルキル)-S-基、(アルキル)-SO₂-基を示し、例えばメチルチオ基、エチルチオ基、メチルスルホニル基、エチルスルホニル基等を挙げることができる。

【0021】モノ又はジアルキルアミノ基とは、アルキル部分が上記の意味である、(アルキル)-NH-基、(アルキル)₂N-基を示し、例えばメチルアミノ基、ジメチルアミノ基等を挙げることができる。

【0022】置換されたカルバモイル基とは、N-モノ置換又はN, N-ジ置換されたカルバモイル基を示し、例えばN, N-ジメチルカルバモイル基等を挙げることができる。

【0023】置換されたチオカルバモイル基とは、N-モノ置換又はN, N-ジ置換されたチオカルバモイル基を示し、例えばN-メチルチオカルバモイル基等を挙げることができる。

【0024】アシルオキシ基及びアルキルスルホニルオキシ基とは、アシル又はアルキルスルホニル部分がそれぞれ上記の意味である(アシル)-O-基、(アルキルスルホニル)-O-基を示し、例えばアセトキシ基又はメシルオキシ基等を挙げることができる。

【0025】含窒素ヘテロ環基とは、5~6員環の含窒素ヘテロ環基を示し、例えばピペリジノ基、モルホリノ基、イミダゾリル基等を挙げることができる。

【0026】塩とは、一般式 [I] で表される化合物と酸との塩又は、一般式 [I] で表される化合物の、スルホンアミドと金属或いは有機塩基との塩であり、酸としては塩酸や臭化水素酸等のハロゲン化水素酸又は硫酸やメタンスルホン酸等のスルホン酸を挙げることができ、金属としてはナトリウムやカリウム等のアルカリ金属、マグネシウムやカルシウム等のアルカリ土類金属を挙げることができ、有機塩基としてはトリエチルアミン、ジイソプロピルアミン等を挙げることができる。

【0027】前記一般式 [I] において、好ましい化合物群としては、 R^1 がトリフルオロメチル基又はジフルオロメチル基であり、 R^2 が水素原子、炭素数が1~3のアルキル基及び炭素数が1~3のアルコキシ基、ハロゲン原子又はメトキシメチル基であり、 R^3 が水素原子又はメトキシメチル基であり、Qが基-CH(NR⁴ R⁵)-であり、 R^4 、 R^5 は同一か又は相異なり、水素原子又は炭素数が1~6のアルキル基であり、 m が1又は2で表される化合物群が挙げられる。

【0028】

【発明の実施の形態】次に、一般式 [I]、[II] で表される本発明化合物の代表的な化合物例を表1~表35に示すが、本発明化合物はこれらに限られるものではない。尚、化合物番号は以後の記載において参照され

る。

【0029】本明細書における表中の次の表記は下記の

Me : メチル基、
 Pr : プロピル基、
 Bu : ブチル基、
 Bu-s : sec-ブチル基、
 Pen : n-ペンチル基、
 Pr-c : シクロプロピル基、
 Pen-c : シクロペンチル基、

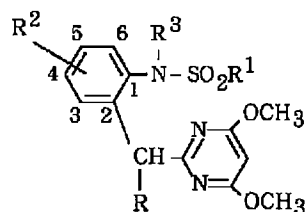
通りそれぞれ該当する基を表す。

【0030】

Et : エチル基、
 Pr-i : イソプロピル基、
 Bu-i : イソブチル基、
 Bu-t : tert-ブチル基、
 Bn : ベンジル基、
 Bu-c : シクロブチル基、
 Ph : フェニル基、

【0031】

【表1】



化合物 番号	R ¹	R ²	R ³	R	融点(°C) 比屈折率(n _D ²⁰)
1-1	CH ₂ F	H	H	N(Et) ₂	137-138
1-2	CH ₂ F	H	H	N(Pr) ₂	1.5350
1-3	CH ₂ F	H	H	N(Me) ₂	94-95
1-4	CH ₂ F	H	H	NHEt	135-137
1-5	CH ₂ F	H	H	NHPr	
1-6	CH ₂ F	H	H	NHPr-i	
1-7	CH ₂ F	H	H	NHMe	174-175
1-8	CH ₂ F	3-F	H	N(Et) ₂	
1-9	CH ₂ F	3-F	H	N(Pr) ₂	
1-10	CH ₂ F	3-F	H	N(Me) ₂	
1-11	CH ₂ F	3-F	H	NHEt	
1-12	CH ₂ F	3-F	H	NHPr	
1-13	CH ₂ F	3-F	H	NHPr-i	
1-14	CH ₂ F	3-F	H	NHMe	
1-15	CH ₂ F	5-F	H	N(Et) ₂	
1-16	CH ₂ F	5-F	H	N(Pr) ₂	
1-17	CH ₂ F	5-F	H	N(Me) ₂	
1-18	CH ₂ F	5-F	H	NHEt	
1-19	CH ₂ F	5-F	H	NHPr	
1-20	CH ₂ F	5-F	H	NHPr-i	
1-21	CH ₂ F	5-F	H	NHMe	
1-22	CH ₂ F	6-Et	H	N(Et) ₂	
1-23	CH ₂ F	6-Et	H	N(Pr) ₂	
1-24	CH ₂ F	6-Et	H	N(Me) ₂	
1-25	CH ₂ F	6-Et	H	NHEt	

【0032】

【表2】

化合物 番 号	R ¹	R ²	R ³	R	融 点(℃) 及 屈折率(n _D ²⁰)
I-26	CH ₂ F	6-Bt	H	NHPr	
I-27	CH ₂ F	6-Bt	H	NHPr-i	
I-28	CH ₂ F	6-Bt	H	NHMe	
I-29	CH ₂ F	6-F	H	N(Et) ₂	
I-30	CH ₂ F	6-F	H	N(Pr) ₂	
I-31	CH ₂ F	6-F	H	N(Me) ₂	
I-32	CH ₂ F	6-F	H	NHEt	
I-33	CH ₂ F	6-F	H	NHPr	
I-34	CH ₂ F	6-F	H	NHPr-i	
I-35	CH ₂ F	6-F	H	NHMe	
I-36	CH ₂ F	6-Me	H	N(Et) ₂	
I-37	CH ₂ F	6-Me	H	N(Pr) ₂	
I-38	CH ₂ F	6-Me	H	N(Me) ₂	
I-39	CH ₂ F	6-Me	H	NHEt	
I-40	CH ₂ F	6-Me	H	NHPr	
I-41	CH ₂ F	6-Me	H	NHPr-i	
I-42	CH ₂ F	6-Me	H	NHMe	
I-43	CH ₂ F	6-OMe	H	N(Et) ₂	
I-44	CH ₂ F	6-OMe	H	N(Pr) ₂	
I-45	CH ₂ F	6-OMe	H	N(Me) ₂	
I-46	CH ₂ F	6-OMe	H	NHEt	
I-47	CH ₂ F	6-OMe	H	NHPr	
I-48	CH ₂ F	6-OMe	H	NHPr-i	
I-49	CH ₂ F	6-OMe	H	NHMe	
I-50	CH ₂ F	6-Pr	H	N(Et) ₂	
I-51	CH ₂ F	6-Pr	H	N(Pr) ₂	
I-52	CH ₂ F	6-Pr	H	N(Me) ₂	
I-53	CH ₂ F	6-Pr	H	NHEt	
I-54	CH ₂ F	6-Pr	H	NHPr	
I-55	CH ₂ F	6-Pr	H	NHPr-i	
I-56	CH ₂ F	6-Pr	H	NHMe	

【0033】

【表3】

化合物 番 号	R ¹	R ²	R ³	R	融 点(°C) 比旋折 率(α_D^{20})
1-57	CH ₂ F	6-CH ₂ OMe	H	N(Et) ₂	
1-58	CH ₂ F	6-CH ₂ OMe	H	N(Pr) ₂	
1-59	CH ₂ F	6-CH ₂ OMe	H	N(Me) ₂	
1-60	CH ₂ F	6-CH ₂ OMe	H	NHEt	
1-61	CH ₂ F	6-CH ₂ OMe	H	NHPr	
1-62	CH ₂ F	6-CH ₂ OMe	H	NHPr-i	
1-63	CH ₂ F	6-CH ₂ OMe	H	NHMe	
1-64	CH ₂ Br	H	H	N(Et) ₂	
1-65	CH ₂ Br	H	H	N(Pr) ₂	
1-66	CH ₂ Br	H	H	N(Me) ₂	
1-67	CH ₂ Br	H	H	NHEt	
1-68	CH ₂ Br	H	H	NHPr	
1-69	CH ₂ Br	H	H	NHPr-i	
1-70	CH ₂ Br	H	H	NHMe	
1-71	CH ₂ Br	3-F	H	N(Et) ₂	
1-72	CH ₂ Br	3-F	H	N(Pr) ₂	
1-73	CH ₂ Br	3-F	H	N(Me) ₂	
1-74	CH ₂ Br	3-F	H	NHEt	
1-75	CH ₂ Br	3-F	H	NHPr	
1-76	CH ₂ Br	3-F	H	NHPr-i	
1-77	CH ₂ Br	3-F	H	NHMe	
1-78	CH ₂ Br	5-F	H	N(Et) ₂	
1-79	CH ₂ Br	5-F	H	N(Pr) ₂	
1-80	CH ₂ Br	5-F	H	N(Me) ₂	
1-81	CH ₂ Br	5-F	H	NHEt	
1-82	CH ₂ Br	5-F	H	NHPr	
1-83	CH ₂ Br	5-F	H	NHPr-i	
1-84	CH ₂ Br	5-F	H	NHMe	
1-85	CH ₂ Br	6-Et	H	N(Et) ₂	
1-86	CH ₂ Br	6-Et	H	N(Pr) ₂	
1-87	CH ₂ Br	6-Et	H	N(Me) ₂	
1-88	CH ₂ Br	6-Et	H	NHEt	

【0034】

【表4】

化合物 番 号	R ¹	R ²	R ³	R	融 点(°C) 旋光折 率(n_D^{20})
1-89	CH ₂ Br	6-Et	H	NHPr	
1-90	CH ₂ Br	6-Et	H	NHPr-i	
1-91	CH ₂ Br	6-Et	H	NHMe	
1-92	CH ₂ Br	6-F	H	N(Bt) ₂	
1-93	CH ₂ Br	6-F	H	N(Pr) ₂	
1-94	CH ₂ Br	6-F	H	N(Me) ₂	
1-95	CH ₂ Br	6-F	H	NHBt	
1-96	CH ₂ Br	6-F	H	NHPr	
1-97	CH ₂ Br	6-F	H	NHPr-i	
1-98	CH ₂ Br	6-F	H	NHMe	
1-99	CH ₂ Br	6-Me	H	N(Bt) ₂	
1-100	CH ₂ Br	6-Me	H	N(Pr) ₂	
1-101	CH ₂ Br	6-Me	H	N(Me) ₂	
1-102	CH ₂ Br	6-Me	H	NHBt	
1-103	CH ₂ Br	6-Me	H	NHPr	
1-104	CH ₂ Br	6-Me	H	NHPr-i	
1-105	CH ₂ Br	6-Me	H	NHMe	
1-106	CH ₂ Br	6-OMe	H	N(Bt) ₂	
1-107	CH ₂ Br	6-OMe	H	N(Pr) ₂	
1-108	CH ₂ Br	6-OMe	H	N(Me) ₂	
1-109	CH ₂ Br	6-OMe	H	NHBt	
1-110	CH ₂ Br	6-OMe	H	NHPr	
1-111	CH ₂ Br	6-OMe	H	NHPr-i	
1-112	CH ₂ Br	6-OMe	H	NHMe	
1-113	CH ₂ Br	6-Pr	H	N(Bt) ₂	
1-114	CH ₂ Br	6-Pr	H	N(Pr) ₂	
1-115	CH ₂ Br	6-Pr	H	N(Me) ₂	
1-116	CH ₂ Br	6-Pr	H	NHBt	
1-117	CH ₂ Br	6-Pr	H	NHPr	
1-118	CH ₂ Br	6-Pr	H	NHPr-i	
1-119	CH ₂ Br	6-Pr	H	NHMe	

【0035】

【表5】

化合物 番 号	R ¹	R ²	R ³	R	融 点(℃) 比旋折 率(n_D^{20})
1-120	CH ₂ Br	6-CH ₂ OMe	H	N(Et) ₂	
1-121	CH ₂ Br	6-CH ₂ OMe	H	N(Pr) ₂	
1-122	CH ₂ Br	6-CH ₂ OMe	H	N(Me) ₂	
1-123	CH ₂ Br	6-CH ₂ OMe	H	NHEt	
1-124	CH ₂ Br	6-CH ₂ OMe	H	NHPr	
1-125	CH ₂ Br	6-CH ₂ OMe	H	NHPr-i	
1-126	CH ₂ Br	6-CH ₂ OMe	H	NHMe	
1-127	CH ₂ Cl	H	H	N(Et) ₂	
1-128	CH ₂ Cl	H	H	N(Pr) ₂	
1-129	CH ₂ Cl	H	H	N(Me) ₂	
1-130	CH ₂ Cl	H	H	NHEt	
1-131	CH ₂ Cl	H	H	NHPr	
1-132	CH ₂ Cl	H	H	NHPr-i	
1-133	CH ₂ Cl	H	H	NHMe	
1-134	CH ₂ Cl	3-F	H	N(Et) ₂	
1-135	CH ₂ Cl	3-F	H	N(Pr) ₂	
1-136	CH ₂ Cl	3-F	H	N(Me) ₂	
1-137	CH ₂ Cl	3-F	H	NHEt	
1-138	CH ₂ Cl	3-F	H	NHPr	
1-139	CH ₂ Cl	3-F	H	NHPr-i	
1-140	CH ₂ Cl	3-F	H	NHMe	
1-141	CH ₂ Cl	5-F	H	N(Et) ₂	
1-142	CH ₂ Cl	5-F	H	N(Pr) ₂	
1-143	CH ₂ Cl	5-F	H	N(Me) ₂	
1-144	CH ₂ Cl	5-F	H	NHEt	
1-145	CH ₂ Cl	5-F	H	NHPr	
1-146	CH ₂ Cl	5-F	H	NHPr-i	
1-147	CH ₂ Cl	5-F	H	NHMe	
1-148	CH ₂ Cl	6-Et	H	N(Et) ₂	
1-149	CH ₂ Cl	6-Et	H	N(Pr) ₂	
1-150	CH ₂ Cl	6-Et	H	N(Me) ₂	
1-151	CH ₂ Cl	6-Et	H	NHEt	

【0036】

【表6】

化合物 番 号	R ¹	R ²	R ³	R	融 点(°C) 旋光屈折 率(n _D ²⁰)
1-152	CH ₂ Cl	6-Et	H	NHPr	
1-153	CH ₂ Cl	6-Et	H	NHPr-i	
1-154	CH ₂ Cl	6-Et	H	NHMe	
1-155	CH ₂ Cl	6-F	H	N(Bt) ₂	
1-156	CH ₂ Cl	6-F	H	N(Pr) ₂	
1-157	CH ₂ Cl	6-F	H	N(Me) ₂	
1-158	CH ₂ Cl	6-F	H	NHBt	
1-159	CH ₂ Cl	6-F	H	NHPr	
1-160	CH ₂ Cl	6-F	H	NHPr-i	
1-161	CH ₂ Cl	6-F	H	NHMe	
1-162	CH ₂ Cl	6-Me	H	N(Bt) ₂	
1-163	CH ₂ Cl	6-Me	H	N(Pr) ₂	
1-164	CH ₂ Cl	6-Me	H	N(Me) ₂	
1-165	CH ₂ Cl	6-Me	H	NHBt	
1-166	CH ₂ Cl	6-Me	H	NHPr	
1-167	CH ₂ Cl	6-Me	H	NHPr-i	
1-168	CH ₂ Cl	6-Me	H	NHMe	
1-169	CH ₂ Cl	6-OMe	H	N(Bt) ₂	
1-170	CH ₂ Cl	6-OMe	H	N(Pr) ₂	
1-171	CH ₂ Cl	6-OMe	H	N(Me) ₂	
1-172	CH ₂ Cl	6-OMe	H	NHBt	
1-173	CH ₂ Cl	6-OMe	H	NHPr	
1-174	CH ₂ Cl	6-OMe	H	NHPr-i	
1-175	CH ₂ Cl	6-OMe	H	NHMe	
1-176	CH ₂ Cl	6-Pr	H	N(Bt) ₂	
1-177	CH ₂ Cl	6-Pr	H	N(Pr) ₂	
1-178	CH ₂ Cl	6-Pr	H	N(Me) ₂	
1-179	CH ₂ Cl	6-Pr	H	NHBt	
1-180	CH ₂ Cl	6-Pr	H	NHPr	
1-181	CH ₂ Cl	6-Pr	H	NHPr-i	
1-182	CH ₂ Cl	6-Pr	H	NHMe	

【0037】

【表7】

化合物 番 号	R ¹	R ²	R ³	R	融 点 (°C) 比旋折 率 (m _D ²⁰)
1-183	CH ₂ Cl	6-CH ₂ OMe	H	N(Et) ₂	
1-184	CH ₂ Cl	6-CH ₂ OMe	H	N(Pr) ₂	
1-185	CH ₂ Cl	6-CH ₂ OMe	H	N(Me) ₂	
1-186	CH ₂ Cl	6-CH ₂ OMe	H	NHEt	
1-187	CH ₂ Cl	6-CH ₂ OMe	H	NHPr	
1-188	CH ₂ Cl	6-CH ₂ OMe	H	NHPr-i	
1-189	CH ₂ Cl	6-CH ₂ OMe	H	NHMe	
1-190	CH ₂ CN	H	H	N(Et) ₂	
1-191	CH ₂ CN	H	H	N(Pr) ₂	
1-192	CH ₂ CN	H	H	N(Me) ₂	
1-193	CH ₂ CN	H	H	NHEt	
1-194	CH ₂ CN	H	H	NHPr	
1-195	CH ₂ CN	H	H	NHPr-i	
1-196	CH ₂ CN	H	H	NHMe	
1-197	CH ₂ CN	3-F	H	N(Et) ₂	
1-198	CH ₂ CN	3-F	H	N(Pr) ₂	
1-199	CH ₂ CN	3-F	H	N(Me) ₂	
1-200	CH ₂ CN	3-F	H	NHEt	
1-201	CH ₂ CN	3-F	H	NHPr	
1-202	CH ₂ CN	3-F	H	NHPr-i	
1-203	CH ₂ CN	3-F	H	NHMe	
1-204	CH ₂ CN	5-F	H	N(Et) ₂	
1-205	CH ₂ CN	5-F	H	N(Pr) ₂	
1-206	CH ₂ CN	5-F	H	N(Me) ₂	
1-207	CH ₂ CN	5-F	H	NHEt	
1-208	CH ₂ CN	5-F	H	NHPr	
1-209	CH ₂ CN	5-F	H	NHPr-i	
1-210	CH ₂ CN	5-F	H	NHMe	
1-211	CH ₂ CN	6-Et	H	N(Et) ₂	
1-212	CH ₂ CN	6-Et	H	N(Pr) ₂	
1-213	CH ₂ CN	6-Et	H	N(Me) ₂	
1-214	CH ₂ CN	6-Et	H	NHEt	


【 0 0 3 8 】






【 表 8 】

化合物 番 号	R ¹	R ²	R ³	R	融 点 (°C) 比旋折 率 (α _D ²⁰)
1-215	CH ₂ CN	6-Et	H	NHPr	
1-216	CH ₂ CN	6-Et	H	NHPr-i	
1-217	CH ₂ CN	6-Et	H	NHMe	
1-218	CH ₂ CN	6-F	H	N(Bt) ₂	
1-219	CH ₂ CN	6-F	H	N(Pr) ₂	
1-220	CH ₂ CN	6-F	H	N(Me) ₂	
1-221	CH ₂ CN	6-F	H	NHBt	
1-222	CH ₂ CN	6-F	H	NHPr	
1-223	CH ₂ CN	6-F	H	NHPr-i	
1-224	CH ₂ CN	6-F	H	NHMe	
1-225	CH ₂ CN	6-Me	H	N(Bt) ₂	
1-226	CH ₂ CN	6-Me	H	N(Pr) ₂	
1-227	CH ₂ CN	6-Me	H	N(Me) ₂	
1-228	CH ₂ CN	6-Me	H	NHBt	
1-229	CH ₂ CN	6-Me	H	NHPr	
1-230	CH ₂ CN	6-Me	H	NHPr-i	
1-231	CH ₂ CN	6-Me	H	NHMe	
1-232	CH ₂ CN	6-OMe	H	N(Bt) ₂	
1-233	CH ₂ CN	6-OMe	H	N(Pr) ₂	
1-234	CH ₂ CN	6-OMe	H	N(Me) ₂	
1-235	CH ₂ CN	6-OMe	H	NHBt	
1-236	CH ₂ CN	6-OMe	H	NHPr	
1-237	CH ₂ CN	6-OMe	H	NHPr-i	
1-238	CH ₂ CN	6-OMe	H	NHMe	
1-239	CH ₂ CN	6-Pr	H	N(Bt) ₂	
1-240	CH ₂ CN	6-Pr	H	N(Pr) ₂	
1-241	CH ₂ CN	6-Pr	H	N(Me) ₂	
1-242	CH ₂ CN	6-Pr	H	NHBt	
1-243	CH ₂ CN	6-Pr	H	NHPr	
1-244	CH ₂ CN	6-Pr	H	NHPr-i	
1-245	CH ₂ CN	6-Pr	H	NHMe	

【 0 0 3 9 】

【 表 9 】



化合物 番 号	R ¹	R ²	R ³	R	融 点(°C) 比屈折 率(n _D ²⁰)
I-246	CH ₂ CN	6-CH ₂ OMe	H	N(Et) ₂	108-110
I-247	CH ₂ CN	6-CH ₂ OMe	H	N(Pr) ₂	
I-248	CH ₂ CN	6-CH ₂ OMe	H	N(Me) ₂	
I-249	CH ₂ CN	6-CH ₂ OMe	H	NHEt	
I-250	CH ₂ CN	6-CH ₂ OMe	H	NHPr	
I-251	CH ₂ CN	6-CH ₂ OMe	H	NHPr-i	
I-252	CH ₂ CN	6-CH ₂ OMe	H	NHMe	
I-253	CHF ₂	H	H	N(Et) ₂	
I-254	CHF ₂	H	Me	N(Et) ₂	67- 69
I-255	CHF ₂	H	Bn	N(Et) ₂	
I-256	CHF ₂	H	CH ₂ OMe	N(Et) ₂	
I-257	CHF ₂	H	H	N(Et)Pr	
I-258	CHF ₂	H	H	N(Et)Bu	
I-259	CHF ₂	H	H	N(Pr) ₂	
I-260	CHF ₂	H	H	N(Pr-1) ₂	
I-261	CHF ₂	H	H	N(Bu) ₂	
I-262	CHF ₂	H	H	N(Bu-i) ₂	117-119
I-263	CHF ₂	H	H	N(CH ₂ CH ₂ CN) ₂	
I-264	CHF ₂	H	H	N(CH ₂ CH ₂ OH) ₂	125-126
I-265	CHF ₂	H	H	N(Me) ₂	
I-266	CHF ₂	H	H	N(Me)Et	1.5392
I-267	CHF ₂	H	H	N(Me)Pr	
I-268	CHF ₂	H	H	N(Me)Bu	109-110
I-269	CHF ₂	H	H	NHEt	
I-270	CHF ₂	H	H	NHPr-c	126-128
I-271	CHF ₂	H	H	NHPr	
I-272	CHF ₂	H	H	NHPr-i	134-136
I-273	CHF ₂	H	H	NHBu	
I-274	CHF ₂	H	H	NHBu-i	125-126
I-275	CHF ₂	H	H	NHBu-t	
I-276	CHF ₂	H	H	NHPen	81- 83
I-277	CHF ₂	H	H	NH- 	

化合物 番 号	R ¹	R ²	R ³	R	融 点(°C) 及 屈折率(n _D ²⁰)
1-278	CHF ₂	H	H	NHC ₆ H ₁₃	76-78
1-279	CHF ₂	H	H	NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	1.4944
1-280	CHF ₂	H	H	NHCH ₂ CF ₃	1.5000
1-281	CHF ₂	H	H	NHCH ₂ CH=CH ₂	137-138
1-282	CHF ₂	H	H	NHCH ₂ C≡CH	87-88
1-283	CHF ₂	H	H	NHCH ₂ CH ₂ OMe	122-123
1-284	CHF ₂	H	H	NHBn	105-106
1-285	CHF ₂	H	H	NHMe	174-175
1-286	CHF ₂	H	H	NHNHCOMe	74-75
1-287	CHF ₂	H	H	NHNHCOPh	82-84
1-288	CHF ₂	H	H	NHNHMe	1.5385
1-289	CHF ₂	H	H	NHN(Me) ₂	145-146
1-290	CHF ₂	H	H	NHPh	145-146
1-291	CHF ₂	H	H	NHPh(2-OMe)	128-129
1-292	CHF ₂	H	H	NHPh(3-OMe)	165-168
1-293	CHF ₂	H	H	NHPh(4-OMe)	1.5452
1-294	CHF ₂	H	H		1.5396
1-295	CHF ₂	H	H		1.5342
1-296	CHF ₂	H	H		143-144
1-297	CHF ₂	3-F	H		174-175
1-298	CHF ₂	3-F	H	N(Et) ₂	119-120
1-299	CHF ₂	3-F	H	NHPr	111-112
1-300	CHF ₂	3-F	H	NHPr-i	143-145
1-301	CHF ₂	5-F	H		1.5232
1-302	CHF ₂	5-F	H	N(Et) ₂	113-114

【0041】

【表11】

化合物 番 号	R ¹	R ²	R ³	R	融 点(°C) 折 射 率(n _D ²⁰)
I-303	CHF ₂	5-F	H	N(Pr) ₂	124-125
I-304	CHF ₂	5-F	H	N(Pr-1) ₂	137-139
I-305	CHF ₂	5-F	H	N(Bu) ₂	113-114
I-306	CHF ₂	5-F	H	N(Bu-1) ₂	147-149
I-307	CHF ₂	5-F	H	N(Bu-s) ₂	137-138
I-308	CHF ₂	5-F	H	N(CH ₂ CH ₂ OH) ₂	128-129
I-309	CHF ₂	5-F	H	N(Me) ₂	82- 83
I-310	CHF ₂	5-F	H	NHEt	195-197
I-311	CHF ₂	5-F	H	NHPr	178-179
I-312	CHF ₂	5-F	H	NHPr-i	180-181
I-313	CHF ₂	5-F	H	NBBu	192-193
I-314	CHF ₂	5-F	H	NBBu-i	149-151
I-315	CHF ₂	5-F	H	NBBu-s	143-145
I-316	CHF ₂	5-F	H	NBBu-t	49- 50
I-317	CHF ₂	5-F	H	NHCH ₂ C≡CH	140-141
I-318	CHF ₂	5-F	H	NHPr-c	154-155
I-319	CHF ₂	5-F	H	NHCH ₂ CF ₃	1.4994
I-320	CHF ₂	5-F	H	NHCH ₂ CH=CH ₂	167-169
I-321	CHF ₂	5-F	H	NHCH ₂ CH ₂ OMe	113-114
I-322	CHF ₂	5-F	H	NBBn	138-139
I-323	CHF ₂	5-F	H	NHMe	208-210
I-324	CHF ₂	5-F	H	NENHMe	121-123
I-325	CHF ₂	5-F	H	NENHCOMe	188-189
I-326	CHF ₂	5-F	H	NENHCO ₂ Et	122-124
I-327	CHF ₂	5-F	H	NENHPh	136-137
I-328	CHF ₂	5-F	H	NEN(OMe) ₂	130-131
I-329	CHF ₂	5-F	H	NHPh	149-150
I-330	CHF ₂	6-Et	H	N(Et) ₂	128-130
I-331	CHF ₂	6-Et	H	N(Bu) ₂	116-117
I-332	CHF ₂	6-Et	H	N(Me) ₂	148-150
I-333	CHF ₂	6-Et	H	NHEt	202-205
I-334	CHF ₂	6-Et	H	NHPr	194-195

化合物 番 号	R ¹	R ²	R ³	R	融 点(°C) 結晶 屈折率(n _D ²⁰)
I-335	CHF ₂	6-CH ₂ OEt	H	N(Et) ₂	142-143
I-336	CHF ₂	6-CH ₂ OEt	H	NHPr	162-163
I-337	CHF ₂	6-F	H	N(Et) ₂	56- 59
I-338	CHF ₂	6-F	H	N(Pr) ₂	128-129
I-339	CHF ₂	6-F	H	N(Me) ₂	192-193
I-340	CHF ₂	6-F	H	NHEt	187-188
I-341	CHF ₂	6-F	H	NHBu	159-160
I-342	CHF ₂	6-F	H	NHMe	209-210
I-343	CHF ₂	6-Me	H	N(Et) ₂	118-120
I-344	CHF ₂	6-Me	H	N(Pr) ₂	133-134
I-345	CHF ₂	6-Me	H	NHEt	204-205
I-346	CHF ₂	6-Me	H	NHPr	185-186
I-347	CHF ₂	6-OMe	H	N(Et) ₂	93- 94
I-348	CHF ₂	6-OMe	H	N(Et)Bu	測定不可
I-349	CHF ₂	6-OMe	H	N(Me) ₂	118-119
I-350	CHF ₂	6-OMe	H	NHEt	209-210
I-351	CHF ₂	6-OMe	H	NHBu	132-133
I-352	CHF ₂	6-CH ₂ OMe	H		測定不可
I-353	CHF ₂	6-CH ₂ OMe	H	N(Et) ₂	124-125
I-354	CHF ₂	6-CH ₂ OMe	H	N(Et)Bu	78- 80
I-355	CHF ₂	6-CH ₂ OMe	H	N(Pr) ₂	123-124
I-356	CHF ₂	6-CH ₂ OMe	H	N(Pr-i) ₂	68- 70
I-357	CHF ₂	6-CH ₂ OMe	H	N(Bu) ₂	89- 90
I-358	CHF ₂	6-CH ₂ OMe	H	N(Me) ₂	159-160
I-359	CHF ₂	6-CH ₂ OMe	H	NHEt	188-189
I-360	CHF ₂	6-CH ₂ OMe	H	NHPr	189-190
I-361	CHF ₂	6-CH ₂ OMe	H	NHPr-i	197-198
I-362	CHF ₂	6-CH ₂ OMe	H	NHBu	175-176
I-363	CHF ₂	6-CH ₂ OMe	H	NHPen	173-174
I-364	CHF ₂	6-CH ₂ OMe	H	NH 	185-187

【0043】

【表13】

化合物 番 号	R ¹	R ²	R ³	R	融 点(℃) 純品 屈折率(n _D ²⁰)
I-365	CHF ₂	6-CH ₂ OMe	H	NHMe	198-200
I-366	CHF ₂	6-Pr	H	N(Et) ₂	123-125
I-367	CHF ₂	6-Pr	H	N(Pr) ₂	139-141
I-368	CHF ₂	6-Pr	H	N(Me) ₂	185-166
I-369	CHF ₂	6-Pr	H	NHEt	210-211
I-370	CHF ₂	6-Pr	H	NHPr	198-200
I-371	CHF ₂	6-Pr	H	NHPr-i	156-158
I-372	CHF ₂	6-Pr	H	NHMe	180-181
I-373	CHCl ₂	H	H	N(Et) ₂	
I-374	CHCl ₂	H	H	N(Pr) ₂	
I-375	CHCl ₂	H	H	N(Me) ₂	
I-376	CHCl ₂	H	H	NHEt	
I-377	CHCl ₂	H	H	NHPr	
I-378	CHCl ₂	H	H	NHPr-i	
I-379	CHCl ₂	H	H	NHMe	
I-380	CHCl ₂	3-F	H	N(Et) ₂	
I-381	CHCl ₂	3-F	H	N(Pr) ₂	
I-382	CHCl ₂	3-F	H	N(Me) ₂	
I-383	CHCl ₂	3-F	H	NHEt	
I-384	CHCl ₂	3-F	H	NHPr	
I-385	CHCl ₂	3-F	H	NHPr-i	
I-386	CHCl ₂	3-F	H	NHMe	
I-387	CHCl ₂	5-F	H	N(Et) ₂	
I-388	CHCl ₂	5-F	H	N(Pr) ₂	
I-389	CHCl ₂	5-F	H	N(Me) ₂	
I-390	CHCl ₂	5-F	H	NHEt	
I-391	CHCl ₂	5-F	H	NHPr	
I-392	CHCl ₂	5-F	H	NHPr-i	
I-393	CHCl ₂	5-F	H	NHMe	
I-394	CHCl ₂	6-F	H	N(Et) ₂	
I-395	CHCl ₂	6-F	H	N(Pr) ₂	
I-396	CHCl ₂	6-F	H	N(Me) ₂	

【 0 0 4 4 】

【 表 1 4 】

化合物 番 号	R ¹	R ²	R ³	R	融 点(℃) 結晶 屈折率(n _D ²⁰)
I-397	CHCl ₂	6-F	H	NHEt	
I-398	CHCl ₂	6-F	H	NHPr	
I-399	CHCl ₂	6-F	H	NHPr-i	
I-400	CHCl ₂	6-F	H	NHMe	
I-401	CHCl ₂	6-Bt	H	N(Et) ₂	
I-402	CHCl ₂	6-Bt	H	N(Pr) ₂	
I-403	CHCl ₂	6-Bt	H	N(Me) ₂	
I-404	CHCl ₂	6-Bt	H	NHEt	
I-405	CHCl ₂	6-Bt	H	NHPr	
I-406	CHCl ₂	6-Bt	H	NHPr-i	
I-407	CHCl ₂	6-Bt	H	NHMe	
I-408	CHCl ₂	6-Me	H	N(Et) ₂	
I-409	CHCl ₂	6-Me	H	N(Pr) ₂	
I-410	CHCl ₂	6-Me	H	N(Me) ₂	
I-411	CHCl ₂	6-Me	H	NHEt	
I-412	CHCl ₂	6-Me	H	NHPr	
I-413	CHCl ₂	6-Me	H	NHPr-i	
I-414	CHCl ₂	6-Me	H	NHMe	
I-415	CHCl ₂	6-OMe	H	N(Et) ₂	
I-416	CHCl ₂	6-OMe	H	N(Pr) ₂	
I-417	CHCl ₂	6-OMe	H	N(Me) ₂	
I-418	CHCl ₂	6-OMe	H	NHEt	
I-419	CHCl ₂	6-OMe	H	NHPr	
I-420	CHCl ₂	6-OMe	H	NHPr-i	
I-421	CHCl ₂	6-OMe	H	NHMe	
I-422	CHCl ₂	6-CH ₂ OMe	H	N(Et) ₂	
I-423	CHCl ₂	6-CH ₂ OMe	H	N(Pr) ₂	
I-424	CHCl ₂	6-CH ₂ OMe	H	N(Me) ₂	
I-425	CHCl ₂	6-CH ₂ OMe	H	NHEt	
I-426	CHCl ₂	6-CH ₂ OMe	H	NHPr	
I-427	CHCl ₂	6-CH ₂ OMe	H	NHPr-i	
I-428	CHCl ₂	6-CH ₂ OMe	H	NHMe	

【0045】

【表15】

化合物 番 号	R ¹	R ²	R ³	R	融 点(°C) 比 屈折率(n _D ²⁰)
1-429	CHCl ₂	6-Pr	H	N(Bt) ₂	
1-430	CHCl ₂	6-Pr	H	N(Pr) ₂	
1-431	CHCl ₂	6-Pr	H	N(Me) ₂	
1-432	CHCl ₂	6-Pr	H	NHBt	
1-433	CHCl ₂	6-Pr	H	NHPr	
1-434	CHCl ₂	6-Pr	H	NHPr-i	
1-435	CHCl ₂	6-Pr	H	NHMe	
1-436	CF ₃	3-F	H	N(Bt) ₂	
1-437	CF ₃	3-F	H	N(Pr) ₂	
1-438	CF ₃	3-F	H	N(Me) ₂	
1-439	CF ₃	3-F	H	NHBt	
1-440	CF ₃	3-F	H	NHPr	
1-441	CF ₃	3-F	H	NHPr-i	
1-442	CF ₃	3-F	H	NHMe	
1-443	CF ₃	5-F	H	N(Bt) ₂	
1-444	CF ₃	5-F	H	N(Pr) ₂	
1-445	CF ₃	5-F	H	N(Me) ₂	
1-446	CF ₃	5-F	H	NHBt	
1-447	CF ₃	5-F	H	NHPr	
1-448	CF ₃	5-F	H	NHPr-i	
1-449	CF ₃	5-F	H	NHMe	
1-450	CF ₃	6-F	H	N(Bt) ₂	
1-451	CF ₃	6-F	H	N(Pr) ₂	
1-452	CF ₃	6-F	H	N(Me) ₂	
1-453	CF ₃	6-F	H	NHBt	
1-454	CF ₃	6-F	H	NHPr	
1-455	CF ₃	6-F	H	NHPr-i	
1-456	CF ₃	6-F	H	NHMe	
1-457	CF ₃	6-Me	H	N(Bt) ₂	
1-458	CF ₃	6-Me	H	N(Pr) ₂	
1-459	CF ₃	6-Me	H	N(Me) ₂	
1-460	CF ₃	6-Me	H	NHBt	






【 0046 】

【表 16】

化合物 番 号	R ¹	R ²	R ³	R	融 点(℃) 結晶 屈折率(n _D ²⁰)
I-461	CF ₃	6-Me	H	NHPr	
I-462	CF ₃	6-Me	H	NHPr-i	
I-463	CF ₃	6-Me	H	NHMe	
I-464	CF ₃	6-Et	H	N(Et) ₂	
I-465	CF ₃	6-Et	H	N(Pr) ₂	
I-466	CF ₃	6-Et	H	N(Me) ₂	
I-467	CF ₃	6-Et	H	NHEt	
I-468	CF ₃	6-Et	H	NHPr	
I-469	CF ₃	6-Et	H	NHPr-i	
I-470	CF ₃	6-Et	H	NHMe	
I-471	CF ₃	6-Pr	H	N(Et) ₂	
I-472	CF ₃	6-Pr	H	N(Pr) ₂	
I-473	CF ₃	6-Pr	H	N(Me) ₂	
I-474	CF ₃	6-Pr	H	NHEt	
I-475	CF ₃	6-Pr	H	NHPr	
I-476	CF ₃	6-Pr	H	NHPr-i	
I-477	CF ₃	6-Pr	H	NHMe	
I-478	CF ₃	6-OMe	H	N(Et) ₂	
I-479	CF ₃	6-OMe	H	N(Pr) ₂	
I-480	CF ₃	6-OMe	H	N(Me) ₂	
I-481	CF ₃	6-OMe	H	NHEt	
I-482	CF ₃	6-OMe	H	NHPr	
I-483	CF ₃	6-OMe	H	NHPr-i	
I-484	CF ₃	6-OMe	H	NHMe	
I-485	CF ₃	6-CH ₂ OMe	H	N(Et) ₂	
I-486	CF ₃	6-CH ₂ OMe	H	N(Pr) ₂	
I-487	CF ₃	6-CH ₂ OMe	H	N(Me) ₂	
I-488	CF ₃	6-CH ₂ OMe	H	NHEt	
I-489	CF ₃	6-CH ₂ OMe	H	NHPr	
I-490	CF ₃	6-CH ₂ OMe	H	NHPr-i	
I-491	CF ₃	6-CH ₂ OMe	H	NHMe	


【0047】

【表17】

化合物 番 号	R ¹	R ²	R ³	R	融 点(°C) 結晶 屈折率(n _D ²⁰)
I-492	CF ₃	H	H	N(Bt) ₂	181-182
I-493	CF ₃	H	H	N(Bt)Pr	208-210
I-494	CF ₃	H	H	N(Bt)Bu	103-105
I-495	CF ₃	H	H	N(Bt)Ph	1.5428
I-496	CF ₃	H	H	N(Pr) ₂	140-141
I-497	CF ₃	H	H	N(Pr-i) ₂	175-176
I-498	CF ₃	H	H	N(Bu) ₂	110-111
I-499	CF ₃	H	H	N(Bu-i) ₂	158-159
I-500	CF ₃	H	H	N(Bu-s) ₂	127-128
I-501	CF ₃	H	H	N(Pen) ₂	1.5258
I-502	CF ₃	H	H	N(C ₆ H ₁₃) ₂	1.5191
I-503	CF ₃	H	H	N(CH ₂ C≡CH) ₂	1.5269
I-504	CF ₃	H	H	N(CH ₂ CH=CH ₂) ₂	1.5364
I-505	CF ₃	H	H	N(CH ₂ CH ₂ OH) ₂	140-141
I-506	CF ₃	H	H	N(Me) ₂	200-201
I-507	CF ₃	H	H	N(Me)Et	119-121
I-508	CF ₃	H	H		171-173
I-509	CF ₃	H	H		76-78
I-510	CF ₃	H	H		96-97
I-511	CF ₃	H	H		185-186
I-512	CF ₃	H	H		198-199
I-513	CF ₃	H	H	N(Me)Pr	132-135
I-514	CF ₃	H	H	N(Me)Bu	181-182
I-515	CF ₃	H	H	N(Me)COMe	159-160
I-516	CF ₃	H	H	N(Me)Ph	1.5461
I-517	CF ₃	H	H	NH ₂	209-211

【0048】

【表18】

化合物 番 号	R ¹	R ²	R ³	R	融 点(°C) 及 屈折率(n _D ²⁰)
I-518	CF ₃	H	Me	NH ₂	
I-519	CF ₃	H	Bn	NH ₂	
I-520	CF ₃	H	CH ₂ OMe	NH ₂	
I-521	CF ₃	H	H	NHC(Me) ₂ CN	211-212
I-522	CF ₃	H	H	NHEt	218-220
I-523	CF ₃	H	H	NHPr-c	172-173
I-524	CF ₃	H	H	NHPr	215-216
I-525	CF ₃	H	H	NHPr-i	188-189
I-526	CF ₃	H	H	NHEu-c	148-149
I-527	CF ₃	H	H	NHEu	204-205
I-528	CF ₃	H	H	NHEu-i	136-137
I-529	CF ₃	H	H	NHEu-s	174-175
I-530	CF ₃	H	H	NHEu-t	126-127
I-531	CF ₃	H	H	NHPen	154-155
I-532	CF ₃	H	H	NHPen-c	143-145
I-533	CF ₃	H	H	NH- 	151-153
I-534	CF ₃	H	H	NHC ₆ H ₁₃	125-127
I-535	CF ₃	H	H	NHC ₈ H ₁₇	145-146
I-536	CF ₃	H	H	NHCH(Et) ₂	183-185
I-537	CF ₃	H	H	NHCH(Me)Ph	156-158
I-538	CF ₃	H	H	NHCH ₂ C≡CH	144-145
I-539	CF ₃	H	H	NHCH ₂ CF ₃	1, 4947
I-540	CF ₃	H	H	NHCH ₂ CH=CH ₂	182-184
I-541	CF ₃	H	H	NHCH ₂ CH ₂ CH ₂ SM _e	177-179
I-542	CF ₃	H	H	NHCH ₂ CH ₂ OMe	183-185
I-543	CF ₃	H	H	NHBn	166-168
I-544	CF ₃	H	H	NHMe	179-181
I-545	CF ₃	H	H	NHCHO	155-157
I-546	CF ₃	H	H	NHCOMe	177-178
I-547	CF ₃	H	H	NHCONHEt	167-168
I-548	CF ₃	H	H	NHCON(Me) ₂	170-172
I-549	CF ₃	H	H	NHCOCOMe	149-150

【0049】

【表19】

化合物 番 号	R ¹	R ²	R ³	R	融 点(℃) 及 屈折率(n _D ²⁰)
I-550	CF ₃	H	H	NHCSNHMe	76-78
I-551	CF ₃	H	H	NHNHCOMe	147-148
I-552	CF ₃	H	H	NHNHCOOBt	125-126
I-553	CF ₃	H	H	NHNHMe	103-105
I-554	CF ₃	H	H	NHNHPh	154-155
I-555	CF ₃	H	H	NHPh	139-140
I-556	CF ₃	H	H	NHPh(2-Cl)	152-153
I-557	CF ₃	H	H	NHPh(2-Me)	155-156
I-558	CF ₃	H	H	NHPh(2-OMe)	120-121
I-559	CF ₃	H	H	NHPh(3-Cl)	157-158
I-560	CF ₃	H	H	NHPh(3-Me)	142-143
I-561	CF ₃	H	H	NHPh(3-OMe)	104-105
I-562	CF ₃	H	H	NHPh(4-Cl)	159-161
I-563	CF ₃	H	H	NHPh(4-Me)	168-170
I-564	CF ₃	H	H	NHPh(4-OMe)	146-147
I-565	CF ₃	H	H	NHSO ₂ CF ₃	166-167
I-566	CF ₃	H	H	NHSO ₂ CH ₂ Cl	118-120
I-567	CF ₃	H	H	NHSO ₂ Me	171-172
I-568	CF ₃	H	H	N(Ph) ₂	145-146
I-569	CH ₂ F	3, 4-F ₂	H	N(Et) ₂	
I-570	CH ₂ F	3, 5-F ₂	H	N(Et) ₂	
I-571	CH ₂ F	3, 6-F ₂	H	N(Et) ₂	
I-572	CH ₂ F	4, 5-F ₂	H	N(Et) ₂	
I-573	CH ₂ F	4, 6-F ₂	H	N(Et) ₂	
I-574	CH ₂ F	5, 6-F ₂	H	N(Et) ₂	
I-575	CH ₂ F	3, 4-Cl ₂	H	N(Et) ₂	
I-576	CH ₂ F	3, 5-Cl ₂	H	N(Et) ₂	
I-577	CH ₂ F	3, 6-Me ₂	H	N(Et) ₂	
I-578	CH ₂ F	4, 5-Me ₂	H	N(Et) ₂	
I-579	CH ₂ F	4, 6-(OMe) ₂	H	N(Et) ₂	
I-580	CH ₂ F	5, 6-(OMe) ₂	H	N(Et) ₂	

【0050】

【表20】

化合物 番 号	R ¹	R ²	R ³	R	融 点(℃) 及 屈折率(n _D ²⁰)
I-581	CH ₂ Br	3, 4-F ₂	H	N(Et) ₂	
I-582	CH ₂ Br	3, 5-F ₂	H	N(Et) ₂	
I-583	CH ₂ Br	3, 6-F ₂	H	N(Et) ₂	
I-584	CH ₂ Br	4, 5-F ₂	H	N(Et) ₂	
I-585	CH ₂ Br	4, 6-F ₂	H	N(Et) ₂	
I-586	CH ₂ Br	5, 6-F ₂	H	N(Et) ₂	
I-587	CH ₂ Br	3, 4-Cl ₂	H	N(Et) ₂	
I-588	CH ₂ Br	3, 5-Cl ₂	H	N(Et) ₂	
I-589	CH ₂ Br	3, 6-Me ₂	H	N(Et) ₂	
I-590	CH ₂ Br	4, 5-Me ₂	H	N(Et) ₂	
I-591	CH ₂ Br	4, 6-(OMe) ₂	H	N(Et) ₂	
I-592	CH ₂ Br	5, 6-(OMe) ₂	H	N(Et) ₂	
I-593	CH ₂ Cl	3, 4-F ₂	H	N(Et) ₂	
I-594	CH ₂ Cl	3, 5-F ₂	H	N(Et) ₂	
I-595	CH ₂ Cl	3, 6-F ₂	H	N(Et) ₂	
I-596	CH ₂ Cl	4, 5-F ₂	H	N(Et) ₂	
I-597	CH ₂ Cl	4, 6-F ₂	H	N(Et) ₂	
I-598	CH ₂ Cl	5, 6-F ₂	H	N(Et) ₂	
I-599	CH ₂ Cl	3, 4-Cl ₂	H	N(Et) ₂	
I-600	CH ₂ Cl	3, 5-Cl ₂	H	N(Et) ₂	
I-601	CH ₂ Cl	3, 6-Me ₂	H	N(Et) ₂	
I-602	CH ₂ Cl	4, 5-Me ₂	H	N(Et) ₂	
I-603	CH ₂ Cl	4, 6-(OMe) ₂	H	N(Et) ₂	
I-604	CH ₂ Cl	5, 6-(OMe) ₂	H	N(Et) ₂	
I-605	CH ₂ CN	3, 4-F ₂	H	N(Et) ₂	
I-606	CH ₂ CN	3, 5-F ₂	H	N(Et) ₂	
I-607	CH ₂ CN	3, 6-F ₂	H	N(Et) ₂	
I-608	CH ₂ CN	4, 5-F ₂	H	N(Et) ₂	
I-609	CH ₂ CN	4, 6-F ₂	H	N(Et) ₂	
I-610	CH ₂ CN	5, 6-F ₂	H	N(Et) ₂	
I-611	CH ₂ CN	3, 4-Cl ₂	H	N(Et) ₂	
I-612	CH ₂ CN	3, 5-Cl ₂	H	N(Et) ₂	

【0051】

【表21】

化合物 番 号	R ¹	R ²	R ³	R	融 点(°C) 及 屈折率(n _D ²⁰)
I-613	CH ₂ CN	3, 6-Me ₂	H	N(Bt) ₂	
I-614	CH ₂ CN	4, 5-Me ₂	H	N(Bt) ₂	
I-615	CH ₂ CN	4, 6-(OMe) ₂	H	N(Bt) ₂	
I-616	CH ₂ CN	5, 6-(OMe) ₂	H	N(Bt) ₂	
I-617	CHF ₂	3, 4-F ₂	H	N(Bt) ₂	
I-618	CHF ₂	3, 5-F ₂	H	N(Bt) ₂	
I-619	CHF ₂	3, 6-F ₂	H	N(Bt) ₂	
I-620	CHF ₂	4, 5-F ₂	H	N(Bt) ₂	
I-621	CHF ₂	4, 6-F ₂	H	N(Bt) ₂	
I-622	CHF ₂	5, 6-F ₂	H	N(Bt) ₂	
I-623	CHF ₂	3, 4-Cl ₂	H	N(Bt) ₂	
I-624	CHF ₂	3, 5-Cl ₂	H	N(Bt) ₂	
I-625	CHF ₂	3, 6-Me ₂	H	N(Bt) ₂	
I-626	CHF ₂	4, 5-Me ₂	H	N(Bt) ₂	
I-627	CHF ₂	4, 6-(OMe) ₂	H	N(Bt) ₂	
I-628	CHF ₂	5, 6-(OMe) ₂	H	N(Bt) ₂	
I-629	CHCl ₂	3, 4-F ₂	H	N(Bt) ₂	
I-630	CHCl ₂	3, 5-F ₂	H	N(Bt) ₂	
I-631	CHCl ₂	3, 6-F ₂	H	N(Bt) ₂	
I-632	CHCl ₂	4, 5-F ₂	H	N(Bt) ₂	
I-633	CHCl ₂	4, 6-F ₂	H	N(Bt) ₂	
I-634	CHCl ₂	5, 6-F ₂	H	N(Bt) ₂	
I-635	CHCl ₂	3, 4-Cl ₂	H	N(Bt) ₂	
I-636	CHCl ₂	3, 5-Cl ₂	H	N(Bt) ₂	
I-637	CHCl ₂	3, 6-Me ₂	H	N(Bt) ₂	
I-638	CHCl ₂	4, 5-Me ₂	H	N(Bt) ₂	
I-639	CHCl ₂	4, 6-(OMe) ₂	H	N(Bt) ₂	
I-640	CHCl ₂	5, 6-(OMe) ₂	H	N(Bt) ₂	
I-641	CF ₃	3, 4-F ₂	H	N(Bt) ₂	
I-642	CF ₃	3, 5-F ₂	H	N(Bt) ₂	
I-643	CF ₃	3, 6-F ₂	H	N(Bt) ₂	
I-644	CF ₃	4, 5-F ₂	H	N(Bt) ₂	

【0052】

【表22】

化合物 番 号	R ¹	R ²	R ³	R	融 点(°C) 結晶 屈折率(n _D ²⁰)
I-845	CF ₃	4,6-F ₂	H	N(Et) ₂	
I-846	CF ₃	5,6-F ₂	H	N(Et) ₂	
I-847	CF ₃	3,4-Cl ₂	H	N(Et) ₂	
I-848	CF ₃	3,5-Cl ₂	H	N(Et) ₂	
I-849	CF ₃	3,6-Me ₂	H	N(Et) ₂	
I-850	CF ₃	4,5-Me ₂	H	N(Et) ₂	
I-851	CF ₃	4,6-(OMe) ₂	H	N(Et) ₂	
I-852	CF ₃	5,6-(OMe) ₂	H	N(Et) ₂	
I-853	CH ₂ CH=CHCl	H	H	N(Et) ₂	
I-854	CH ₂ CH=CHCl	H	H	N(Pr) ₂	
I-855	CH ₂ CH=CHCl	H	H	N(Me) ₂	
I-856	CH ₂ CH=CHCl	H	H	NHEt	
I-857	CH ₂ CH=CHCl	H	H	NHPr	
I-858	CH ₂ CH=CHCl	H	H	NHPr-i	
I-859	CH ₂ CH=CHCl	H	H	NHMe	
I-860	CH ₂ CH=CHCl	3-F	H	N(Et) ₂	
I-861	CH ₂ CH=CHCl	3-F	H	N(Pr) ₂	
I-862	CH ₂ CH=CHCl	3-F	H	N(Me) ₂	
I-863	CH ₂ CH=CHCl	3-F	H	NHEt	
I-864	CH ₂ CH=CHCl	3-F	H	NHPr	
I-865	CH ₂ CH=CHCl	3-F	H	NHPr-i	
I-866	CH ₂ CH=CHCl	3-F	H	NHMe	
I-867	CH ₂ CH=CHCl	5-F	H	N(Et) ₂	
I-868	CH ₂ CH=CHCl	5-F	H	N(Pr) ₂	
I-869	CH ₂ CH=CHCl	5-F	H	N(Me) ₂	
I-870	CH ₂ CH=CHCl	5-F	H	NHEt	
I-871	CH ₂ CH=CHCl	5-F	H	NHPr	
I-872	CH ₂ CH=CHCl	5-F	H	NHPr-i	
I-873	CH ₂ CH=CHCl	5-F	H	NHMe	
I-874	CH ₂ CH=CHCl	6-F	H	N(Et) ₂	
I-875	CH ₂ CH=CHCl	6-F	H	N(Pr) ₂	
I-876	CH ₂ CH=CHCl	6-F	H	N(Me) ₂	

【0053】







【表23】

化合物 番 号	R ¹	R ²	R ³	R	融 点(°C) 比 屈折率(n _D ²⁰)
I-677	CH ₂ CH=CHC1	6-F	H	NHEt	
I-678	CH ₂ CH=CHC1	6-F	H	NHPr	
I-679	CH ₂ CH=CHC1	6-F	H	NHPr-i	
I-680	CH ₂ CH=CHC1	6-F	H	NHMe	
I-681	CH ₂ CH=CHC1	6-Me	H	N(Et) ₂	
I-682	CH ₂ CH=CHC1	6-Me	H	N(Pr) ₂	
I-683	CH ₂ CH=CHC1	6-Me	H	N(Me) ₂	
I-684	CH ₂ CH=CHC1	6-Me	H	NHEt	
I-685	CH ₂ CH=CHC1	6-Me	H	NHPr	
I-686	CH ₂ CH=CHC1	6-Me	H	NHPr-i	
I-687	CH ₂ CH=CHC1	6-Me	H	NHMe	
I-688	CH ₂ CH=CHC1	6-Et	H	N(Et) ₂	
I-689	CH ₂ CH=CHC1	6-Et	H	N(Pr) ₂	
I-690	CH ₂ CH=CHC1	6-Et	H	N(Me) ₂	
I-691	CH ₂ CH=CHC1	6-Et	H	NHEt	
I-692	CH ₂ CH=CHC1	6-Et	H	NHPr	
I-693	CH ₂ CH=CHC1	6-Et	H	NHPr-i	
I-694	CH ₂ CH=CHC1	6-Et	H	NHMe	
I-695	CH ₂ CH=CHC1	6-Pr	H	N(Et) ₂	
I-696	CH ₂ CH=CHC1	6-Pr	H	N(Pr) ₂	
I-697	CH ₂ CH=CHC1	6-Pr	H	N(Me) ₂	
I-698	CH ₂ CH=CHC1	6-Pr	H	NHEt	
I-699	CH ₂ CH=CHC1	6-Pr	H	NHPr	
I-700	CH ₂ CH=CHC1	6-Pr	H	NHPr-i	
I-701	CH ₂ CH=CHC1	6-Pr	H	NHMe	
I-702	CH ₂ CH=CHC1	6-OMe	H	N(Et) ₂	
I-703	CH ₂ CH=CHC1	6-OMe	H	N(Pr) ₂	
I-704	CH ₂ CH=CHC1	6-OMe	H	N(Me) ₂	
I-705	CH ₂ CH=CHC1	6-OMe	H	NHEt	
I-706	CH ₂ CH=CHC1	6-OMe	H	NHPr	
I-707	CH ₂ CH=CHC1	6-OMe	H	NHPr-i	
I-708	CH ₂ CH=CHC1	6-OMe	H	NHMe	

【0054】


【表24】

化合物 番 号	R ¹	R ²	R ³	R	融 点(°C) 旋光率(n _D ²⁰)
I-709	CH ₂ CH=CHCl	6-CH ₂ OMe	H	N(Et) ₂	123-124
I-710	CH ₂ CH=CHCl	6-CH ₂ OMe	H	N(Pr) ₂	
I-711	CH ₂ CH=CHCl	6-CH ₂ OMe	H	N(Me) ₂	
I-712	CH ₂ CH=CHCl	6-CH ₂ OMe	H	NHEt	
I-713	CH ₂ CH=CHCl	6-CH ₂ OMe	H	NHPr	
I-714	CH ₂ CH=CHCl	6-CH ₂ OMe	H	NHPr-i	
I-715	CH ₂ CH=CHCl	6-CH ₂ OMe	H	NHMe	
I-716	CH ₂ CH=CHCl	3,4-F ₂	H	N(Et) ₂	
I-717	CH ₂ CH=CHCl	3,5-F ₂	H	N(Et) ₂	
I-718	CH ₂ CH=CHCl	3,6-F ₂	H	N(Et) ₂	
I-719	CH ₂ CH=CHCl	4,5-F ₂	H	N(Et) ₂	
I-720	CH ₂ CH=CHCl	4,6-F ₂	H	N(Et) ₂	
I-721	CH ₂ CH=CHCl	5,6-F ₂	H	N(Et) ₂	
I-722	CH ₂ CH=CHCl	3,4-Cl ₂	H	N(Et) ₂	
I-723	CH ₂ CH=CHCl	3,5-Cl ₂	H	N(Et) ₂	
I-724	CH ₂ CH=CHCl	3,6-Me ₂	H	N(Et) ₂	
I-725	CH ₂ CH=CHCl	4,5-Me ₂	H	N(Et) ₂	
I-726	CH ₂ CH=CHCl	4,6-(OMe) ₂	H	N(Et) ₂	
I-727	CH ₂ CH=CHCl	5,6-(OMe) ₂	H	N(Et) ₂	
I-728	CHF ₂	3-F	H	N(Me) ₂	
I-729	CHF ₂	3-F	H	N(Et)Pr	
I-730	CHF ₂	3-F	H	N(Et)Bu	
I-731	CHF ₂	3-F	H	N(Pr) ₂	
I-732	CHF ₂	3-F	H	N(Pr-i) ₂	
I-733	CHF ₂	3-F	H	N(Bu) ₂	
I-734	CHF ₂	3-F	H	N(Bu-i) ₂	
I-735	CHF ₂	3-F	H	N(CH ₂ CH ₂ CN) ₂	
I-736	CHF ₂	3-F	H	N(CH ₂ CH ₂ OH) ₂	
I-737	CHF ₂	3-F	H	N(Me)Et	
I-738	CHF ₂	3-F	H	N(Me)Pr	
I-739	CHF ₂	3-F	H	N(Me)Bu	
I-740	CHF ₂	3-F	H	NHMe	199-200

化合物 番 号	R ¹	R ²	R ³	R	融 点(°C) 旋光率(n _D ²⁰)
I-741	CHF ₂	3-F	H	NHEt	169-170
I-742	CHF ₂	3-F	H	NHPr ⁿ -c	
I-743	CHF ₂	3-F	H	NHBu	
I-744	CHF ₂	3-F	H	NHBu-i	
I-745	CHF ₂	3-F	H	NHBu-t	
I-746	CHF ₂	3-F	H	NHPen	
I-747	CHF ₂	3-F	H	NH- 	
I-748	CHF ₂	3-F	H	NHC ₆ H ₁₃	
I-749	CHF ₂	3-F	H	NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	
I-750	CHF ₂	3-F	H	NHCH ₂ CF ₃	
I-751	CHF ₂	3-F	H	NHCH ₂ CH=CH ₂	
I-752	CHF ₂	3-F	H	NHCH ₂ C≡CH	
I-753	CHF ₂	3-F	H	NHCH ₂ CH ₂ OMe	129-130
I-754	CHF ₂	3-F	H	NHCH ₂ Ph	
I-755	CHF ₂	3-F	H	NHNHCOMe	
I-756	CHF ₂	3-F	H	NHNHCOPh	
I-757	CHF ₂	3-F	H	NHNHMe	
I-758	CHF ₂	3-F	H	NHN(OMe) ₂	
I-759	CHF ₂	3-F	H	NHPh	
I-760	CHF ₂	3-F	H	NHPh(2-OMe)	
I-761	CHF ₂	3-F	H	NHPh(3-OMe)	
I-762	CHF ₂	3-F	H	NHPh(4-OMe)	
I-763	CHF ₂	3-F	H	-N 	1.5410 129-131
I-764	CHF ₂	3-F	H	-N  N-Me	
I-765	CHF ₂	6-Bt	H	-N 	
I-766	CHF ₂	6-Bt	H	-N  N-Me	
I-767	CHF ₂	6-Bt	H	-N 	





【0056】

【表26】

化合物 番 号	R ¹	R ²	R ³	R	融 点(°C) 旋光度 (n _D ²⁰)
I-768	CH ₂ F	6-Et	H	N(Et)Pr	
I-769	CH ₂ F	6-Et	H	N(Et)Bu	
I-770	CH ₂ F	6-Et	H	N(Pr) ₂	
I-771	CH ₂ F	6-Et	H	N(Pr-i) ₂	
I-772	CH ₂ F	6-Et	H	N(Bu-i) ₂	
I-773	CH ₂ F	6-Et	H	N(CH ₂ CH ₂ CN) ₂	
I-774	CH ₂ F	6-Et	H	N(CH ₂ CH ₂ OH) ₂	
I-775	CH ₂ F	6-Et	H	N(Me)Et	
I-776	CH ₂ F	6-Et	H	N(Me)Pr	
I-777	CH ₂ F	6-Et	H	N(Me)Bu	
I-778	CH ₂ F	6-Et	H	NHMe	
I-779	CH ₂ F	6-Et	H	NHPr-c	
I-780	CH ₂ F	6-Et	H	NHPr-i	
I-781	CH ₂ F	6-Et	H	NHBu	
I-782	CH ₂ F	6-Et	H	NHBu-i	
I-783	CH ₂ F	6-Et	H	NHBu-t	
I-784	CH ₂ F	6-Et	H	NHPen	
I-785	CH ₂ F	6-Et	H	NH- 	
I-786	CH ₂ F	6-Et	H	NHC ₆ H ₁₃	
I-787	CH ₂ F	6-Et	H	NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	
I-788	CH ₂ F	6-Et	H	NHCH ₂ CF ₃	
I-789	CH ₂ F	6-Et	H	NHCH ₂ CH=CH ₂	
I-790	CH ₂ F	6-Et	H	NHCH ₂ C≡CH	
I-791	CH ₂ F	6-Et	H	NHCH ₂ CH ₂ OMe	
I-792	CH ₂ F	6-Et	H	NHCH ₂ Ph	
I-793	CH ₂ F	6-Et	H	NHNHCOMe	
I-794	CH ₂ F	6-Et	H	NHNHCOPh	
I-795	CH ₂ F	6-Et	H	NHNHMe	
I-796	CH ₂ F	6-Et	H	NHN(Me) ₂	
I-797	CH ₂ F	6-Et	H	NHPh	
I-798	CH ₂ F	6-Et	H	NHPh(2-OMe)	
I-799	CH ₂ F	6-Et	H	NHPh(3-OMe)	

【0057】

【表27】

化合物 番 号	R ¹	R ²	R ³	R	融 点(°C) 旋光度 (n _D ²⁰)
I-800	CHF ₂	6-Et	H	NHPh(4-OMe)	
I-801	CHF ₂	6-Pr	H		
I-802	CHF ₂	6-Pr	H		
I-803	CHF ₂	6-Pr	H		
I-804	CHF ₂	6-Pr	H	N(Et)Pr	
I-805	CHF ₂	6-Pr	H	N(Et)Bu	
I-806	CHF ₂	6-Pr	H	N(Pr-i) ₂	
I-807	CHF ₂	6-Pr	H	N(Bu) ₂	
I-808	CHF ₂	6-Pr	H	N(Bu-i) ₂	
I-809	CHF ₂	6-Pr	H	N(CH ₂ CH ₂ CN) ₂	
I-810	CHF ₂	6-Pr	H	N(CH ₂ CH ₂ OH) ₂	
I-811	CHF ₂	6-Pr	H	N(Me)Et	
I-812	CHF ₂	6-Pr	H	N(Me)Pr	
I-813	CHF ₂	6-Pr	H	N(Me)Bu	
I-814	CHF ₂	6-Pr	H	NHPr-c	
I-815	CHF ₂	6-Pr	H	NHNBu	
I-816	CHF ₂	6-Pr	H	NHNBu-i	
I-817	CHF ₂	6-Pr	H	NHNBu-t	
I-818	CHF ₂	6-Pr	H	NHPen	
I-819	CHF ₂	6-Pr	H	NH 	
I-820	CHF ₂	6-Pr	H	NHC ₆ H ₁₃	
I-821	CHF ₂	6-Pr	H	NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	
I-822	CHF ₂	6-Pr	H	NHCH ₂ CF ₃	
I-823	CHF ₂	6-Pr	H	NHCH ₂ CH=CH ₂	
I-824	CHF ₂	6-Pr	H	NHCH ₂ C≡CH	
I-825	CHF ₂	6-Pr	H	NHCH ₂ CH ₂ OMe	
I-826	CHF ₂	6-Pr	H	NHCH ₂ Ph	
I-827	CHF ₂	6-Pr	H	NNHCOMe	

【0058】

【表28】

化合物 番 号	R ¹	R ²	R ³	R	融 点(°C) 旋光度 (n _D ²⁰)
I-828	CH ₂	6-Pr	H	NHNHCOPh	1.5291
I-829	CH ₂	6-Pr	H	NHNHMe	
I-830	CH ₂	6-Pr	H	NHN(OMe) ₂	
I-831	CH ₂	6-Pr	H	NHPh	
I-832	CH ₂	6-Pr	H	NHPh(2-OMe)	
I-833	CH ₂	6-Pr	H	NHPh(3-OMe)	
I-834	CH ₂	6-Pr	H	NHPh(4-OMe)	
I-835	CH ₂	6-CH ₂ OMe	H	-N <chem>C1=CC=CC=C1</chem>	
I-836	CH ₂	6-CH ₂ OMe	H	-N <chem>C1=CC=CC=C1</chem> N-Me	
I-837	CH ₂	6-CH ₂ OMe	H	N(Bu-i) ₂	
I-838	CH ₂	6-CH ₂ OMe	H	N(CH ₂ CH ₂ CN) ₂	
I-839	CH ₂	6-CH ₂ OMe	H	N(CH ₂ CH ₂ OH) ₂	
I-840	CH ₂	6-CH ₂ OMe	H	N(Me)Et	
I-841	CH ₂	6-CH ₂ OMe	H	N(Me)Pr	
I-842	CH ₂	6-CH ₂ OMe	H	N(Me)Bu	
I-843	CH ₂	6-CH ₂ OMe	H	NHPr-c	
I-844	CH ₂	6-CH ₂ OMe	H	NHBu-i	
I-845	CH ₂	6-CH ₂ OMe	H	NHBu-t	
I-846	CH ₂	6-CH ₂ OMe	H	NHC ₆ H ₁₃	
I-847	CH ₂	6-CH ₂ OMe	H	NHCH ₂ CF ₂ CF ₃	
I-848	CH ₂	6-CH ₂ OMe	H	NHCH ₂ CF ₃	
I-849	CH ₂	6-CH ₂ OMe	H	NHCH ₂ CH=CH ₂	
I-850	CH ₂	6-CH ₂ OMe	H	NHCH ₂ C≡CH	
I-851	CH ₂	6-CH ₂ OMe	H	NHCH ₂ CH ₂ OMe	
I-852	CH ₂	6-CH ₂ OMe	H	NHCH ₂ Ph	
I-853	CH ₂	6-CH ₂ OMe	H	NHNHCOMe	
I-854	CH ₂	6-CH ₂ OMe	H	NHNHCOPh	
I-855	CH ₂	6-CH ₂ OMe	H	NHNHMe	
I-856	CH ₂	6-CH ₂ OMe	H	NHN(OMe) ₂	140-142

化合物 番 号	R ¹	R ²	R ³	R	融 点(°C) 旋光率(n _D ²⁰)
I-857	CH ₂ F ₂	6-CH ₂ OMe	H	NHPh	
I-858	CH ₂ F ₂	6-CH ₂ OMe	H	NHPh (2-OMe)	
I-859	CH ₂ F ₂	6-CH ₂ OMe	H	NHPh (3-OMe)	
I-860	CH ₂ F ₂	6-CH ₂ OMe	H	NHPh (4-OMe)	
I-861	CH ₂ F ₂	6-CH ₂ OEt	H	-N <chem>C1CCNCC1</chem>	
I-862	CH ₂ F ₂	6-CH ₂ OEt	H	-N <chem>C1CCN(C)CC1</chem>	
I-863	CH ₂ F ₂	6-CH ₂ OEt	H	-N <chem>C1CCOCC1</chem>	
I-864	CH ₂ F ₂	6-CH ₂ OEt	H	N(Me) ₂	
I-865	CH ₂ F ₂	6-CH ₂ OEt	H	N(Et)Pr	
I-866	CH ₂ F ₂	6-CH ₂ OEt	H	N(Et)Bu	
I-867	CH ₂ F ₂	6-CH ₂ OEt	H	N(Pr) ₂	
I-868	CH ₂ F ₂	6-CH ₂ OEt	H	N(Pr-i) ₂	
I-869	CH ₂ F ₂	6-CH ₂ OEt	H	N(Bu) ₂	
I-870	CH ₂ F ₂	6-CH ₂ OEt	H	N(Bu-i) ₂	
I-871	CH ₂ F ₂	6-CH ₂ OEt	H	N(CH ₂ CH ₂ CH ₃) ₂	
I-872	CH ₂ F ₂	6-CH ₂ OEt	H	N(CH ₂ CH ₂ CH ₂ OH) ₂	
I-873	CH ₂ F ₂	6-CH ₂ OEt	H	N(Me)Et	
I-874	CH ₂ F ₂	6-CH ₂ OEt	H	N(Me)Pr	
I-875	CH ₂ F ₂	6-CH ₂ OEt	H	N(Me)Bu	
I-876	CH ₂ F ₂	6-CH ₂ OEt	H	NHMe	
I-877	CH ₂ F ₂	6-CH ₂ OEt	H	NHEt	
I-878	CH ₂ F ₂	6-CH ₂ OEt	H	NHPr-c	
I-879	CH ₂ F ₂	6-CH ₂ OEt	H	NHPr-i	
I-880	CH ₂ F ₂	6-CH ₂ OEt	H	NHBu	
I-881	CH ₂ F ₂	6-CH ₂ OEt	H	NHBu-i	
I-882	CH ₂ F ₂	6-CH ₂ OEt	H	NHBu-t	
I-883	CH ₂ F ₂	6-CH ₂ OEt	H	NHPen	
I-884	CH ₂ F ₂	6-CH ₂ OEt	H	NH <chem>C1=CC=CC=C1</chem>	

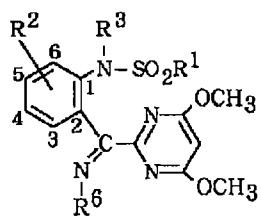
【0060】

【表30】

化合物 番 号	R ¹	R ²	R ³	R	融 点(℃) 折 率(n _D ²⁰)
I-885	CHF ₂	6-CH ₂ OBt	H	NEC ₆ H ₁₃	
I-886	CHF ₂	6-CH ₂ OBt	H	NECH ₂ CF ₂ CF ₃	
I-887	CHF ₂	6-CH ₂ OBt	H	NECH ₂ CF ₃	
I-888	CHF ₂	6-CH ₂ OBt	H	NECH ₂ CH=CH ₂	
I-889	CHF ₂	6-CH ₂ OBt	H	NECH ₂ C≡CH	
I-890	CHF ₂	6-CH ₂ OBt	H	NECH ₂ CH ₂ OMe	
I-891	CHF ₂	6-CH ₂ OBt	H	NECH ₂ Ph	
I-892	CHF ₂	6-CH ₂ OBt	H	NENHCOMe	
I-893	CHF ₂	6-CH ₂ OBt	H	NENHCOPh	
I-894	CHF ₂	6-CH ₂ OBt	H	NENHMe	
I-895	CHF ₂	6-CH ₂ OBt	H	NHN(Me) ₂	
I-896	CHF ₂	6-CH ₂ OBt	H	NHPh	
I-897	CHF ₂	6-CH ₂ OBt	H	NHPh(2-OMe)	
I-898	CHF ₂	6-CH ₂ OBt	H	NHPh(3-OMe)	
I-899	CHF ₂	6-CH ₂ OBt	H	NHPh(4-OMe)	
I-900	CHF ₂	6-CH ₂ OMe	H	N(Bt)Pr	
I-901	CHF ₂	6-CH ₂ OMe	H	N(Me)CH ₂ C≡CH	102-103
I-902	CHF ₂	H	H	NH ₂	166-168

【0061】

【表31】



化合物 番 号	R ¹	R ²	R ³	R ⁶	融 点(℃) または 屈折率(n _D ²⁰)
I1- 1	CH ₂ F	H	H	OMe	
I1- 2	CH ₂ F	H	H	OBt	
I1- 3	CH ₂ F	H	H	OH	
I1- 4	CH ₂ F	H	H	Ph	
I1- 5	CH ₂ F	H	H	Ph (2-Cl)	
I1- 6	CH ₂ F	H	H	NHMe	
I1- 7	CH ₂ F	4-Cl	H	NHSO ₂ CH ₂ F	
I1- 8	CH ₂ F	H	H	N(Me) ₂	
I1- 9	CH ₂ F	H	H	Me	
I1-10	CH ₂ Br	H	H	OMe	
I1-11	CH ₂ Br	H	H	OBt	
I1-12	CH ₂ Br	H	H	OH	
I1-13	CH ₂ Br	H	H	Ph	
I1-14	CH ₂ Br	H	H	Ph (2-Cl)	
I1-15	CH ₂ Br	H	H	NHMe	
I1-16	CH ₂ Br	4-Cl	H	NHSO ₂ CH ₂ Br	
I1-17	CH ₂ Br	H	H	N(Me) ₂	
I1-18	CH ₂ Br	H	H	Me	
I1-19	CH ₂ Cl	H	H	OMe	
I1-20	CH ₂ Cl	H	H	OBt	
I1-21	CH ₂ Cl	H	H	OH	
I1-22	CH ₂ Cl	H	H	Ph	
I1-23	CH ₂ Cl	H	H	Ph (2-Cl)	
I1-24	CH ₂ Cl	H	H	NHMe	
I1-25	CH ₂ Cl	4-Cl	H	NHSO ₂ CH ₂ Cl	

【0062】

【表32】

化合物 番 号	R ¹	R ²	R ³	R ⁶	融 点(℃) 透過 屈折率(n _D ²⁰)
II-26	CH ₂ Cl	H	H	N(Me) ₂	129-130
II-27	CH ₂ Cl	H	H	Me	
II-28	CH ₂ CN	H	H	OMe	
II-29	CH ₂ CN	H	H	OBt	
II-30	CH ₂ CN	H	H	OH	
II-31	CH ₂ CN	H	H	Ph	
II-32	CH ₂ CN	H	H	Ph(2-Cl)	
II-33	CH ₂ CN	H	H	NHMe	
II-34	CH ₂ CN	4-Cl	H	NHSO ₂ CH ₂ CN	
II-35	CH ₂ CN	H	H	N(Me) ₂	
II-36	CH ₂ CN	H	H	Me	
II-37	CHF ₂	H	H	OMe	
II-38	CHF ₂	H	H	OBt	
II-39	CHF ₂	H	H	OH	
II-40	CHF ₂	H	H	Ph	
II-41	CHF ₂	H	H	Ph(2-Cl)	
II-42	CHF ₂	H	H	NHMe	
II-43	CHF ₂	4-Cl	H	NHSO ₂ CHF ₂	
II-44	CHF ₂	H	H	N(Me) ₂	
II-45	CHF ₂	H	H	Me	
II-46	CHCl ₂	H	H	OMe	
II-47	CHCl ₂	H	H	OBt	
II-48	CHCl ₂	H	H	OH	
II-49	CHCl ₂	H	H	Ph	
II-50	CHCl ₂	H	H	Ph(2-Cl)	
II-51	CHCl ₂	H	H	NHMe	
II-52	CHCl ₂	4-Cl	H	NHSO ₂ CHCl ₂	
II-53	CHCl ₂	H	H	N(Me) ₂	
II-54	CHCl ₂	H	H	Me	
II-55	CF ₃	H	H	OMe	89-91
II-56	CF ₃	H	H	OBt	106-107

【0063】

【表33】

化合物 番 号	R ¹	R ²	R ³	R ⁶	融 点(°C) 結晶 屈折率(n _D ²⁰)
11-57	CF ₃	H	H	OH	216-217
11-58	CF ₃	H	H	Ph	131-132
11-59	CF ₃	H	H	Ph(2-Cl)	123-124
11-60	CF ₃	H	H	NHMe	79- 81
11-61	CF ₃	4-Cl	H	NHSO ₂ CF ₃	
11-62	CF ₃	H	H	N(Me) ₂	121-122
11-63	CF ₃	H	H	Me	175-177
11-64	CH ₂ CH=CHCl	H	H	OMe	
11-65	CH ₂ CH=CHCl	H	H	ORt	
11-66	CH ₂ CH=CHCl	H	H	OH	
11-67	CH ₂ CH=CHCl	H	H	Ph	
11-68	CH ₂ CH=CHCl	H	H	Ph(2-Cl)	
11-69	CH ₂ CH=CHCl	H	H	NHMe	
11-70	CH ₂ CH=CHCl	4-Cl	H	NHSO ₂ CH ₂ CH=CHCl	
11-71	CH ₂ CH=CHCl	H	H	N(Me) ₂	
11-72	CH ₂ CH=CHCl	H	H	Me	
11-73	CHF ₂	3-F	H	Ph	
11-74	CHF ₂	3-F	H	Et	
11-75	CHF ₂	3-F	H	Pr-i	
11-76	CHF ₂	3-F	H	Pr	
11-77	CHF ₂	3-F	H	Me	
11-78	CHF ₂	3-F	H	N(Me) ₂	112-113
11-79	CHF ₂	3-F	H	NH ₂	
11-80	CHF ₂	3-F	H	NHMe	123-124
11-81	CHF ₂	3-F	H	NHSO ₂ CHF ₂	
11-82	CHF ₂	6-Et	H	Ph	
11-83	CHF ₂	6-Et	H	Et	
11-84	CHF ₂	6-Et	H	Pr-i	
11-85	CHF ₂	6-Et	H	Pr	
11-86	CHF ₂	6-Et	H	Me	
11-87	CHF ₂	6-Et	H	N(Me) ₂	
11-88	CHF ₂	6-Et	H	NH ₂	

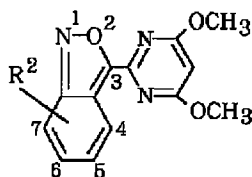
【0064】

【表34】

化合物 番 号	R ¹	R ²	R ³	R ⁶	融 点(℃) 結晶 屈折率(n _D ²⁰)
II-89	CHF ₂	6-Et	H	NHMe	
II-90	CHF ₂	6-Et	H	NHSO ₂ CHF ₂	
II-91	CHF ₂	6-Pr	H	Ph	
II-92	CHF ₂	6-Pr	H	Et	
II-93	CHF ₂	6-Pr	H	Pr-i	
II-94	CHF ₂	6-Pr	H	Pr	
II-95	CHF ₂	6-Pr	H	Me	
II-96	CHF ₂	6-Pr	H	N(Me) ₂	
II-97	CHF ₂	6-Pr	H	NH ₂	
II-98	CHF ₂	6-Pr	H	NHMe	
II-99	CHF ₂	6-Pr	H	NHSO ₂ CHF ₂	
II-100	CHF ₂	6-CH ₂ OMe	H	Ph	
II-101	CHF ₂	6-CH ₂ OMe	H	Et	
II-102	CHF ₂	6-CH ₂ OMe	H	Pr-i	
II-103	CHF ₂	6-CH ₂ OMe	H	Pr	
II-104	CHF ₂	6-CH ₂ OMe	H	Me	
II-105	CHF ₂	6-CH ₂ OMe	H	N(Me) ₂	125-126
II-106	CHF ₂	6-CH ₂ OMe	H	NH ₂	
II-107	CHF ₂	6-CH ₂ OMe	H	NHMe	1.5602
II-108	CHF ₂	6-CH ₂ OMe	H	NHSO ₂ CHF ₂	
II-109	CHF ₂	6-CH ₂ OBt	H	Ph	
II-110	CHF ₂	6-CH ₂ OBt	H	Et	
II-111	CHF ₂	6-CH ₂ OBt	H	Pr-i	
II-112	CHF ₂	6-CH ₂ OBt	H	Pr	
II-113	CHF ₂	6-CH ₂ OBt	H	Me	
II-114	CHF ₂	6-CH ₂ OBt	H	N(Me) ₂	
II-115	CHF ₂	6-CH ₂ OBt	H	NH ₂	
II-116	CHF ₂	6-CH ₂ OBt	H	NHMe	
II-117	CHF ₂	6-CH ₂ OBt	H	NHSO ₂ CHF ₂	
II-118	CHF ₂	5-F	H	Me	128-131
II-119	CHF ₂	H	H	Bu	95- 96
II-120	CHF ₂	H	H	Et	107-110

【0065】

【表35】



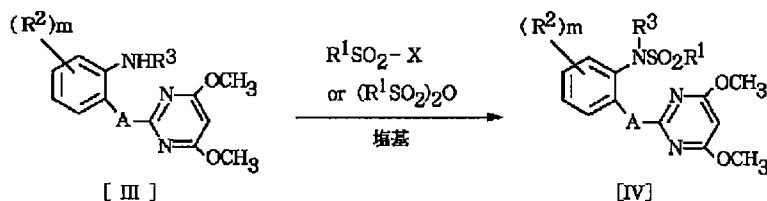
【0066】次に、一般式【I】で示される本発明化合物は、以下に示す製造法に従って製造することができるが、これらの方法に限定されるものではない。

【0067】＜製造法1＞

【0068】

【化5】

化合物 番 号	R ²	融 点(℃) ±3 屈折率(n _D ²⁰)
III- 1	H	
III- 2	4-F	145 - 147
III- 3	5-F	
III- 4	6-F	
III- 5	7-F	
III- 6	4-Cl	
III- 7	5-Cl	198-200
III- 8	6-Cl	
III- 9	7-Cl	
III-10	4-Me	
III-11	5-Me	
III-12	6-Me	
III-13	7-Me	
III-14	4-OMe	
III-15	5-OMe	
III-16	6-OMe	
III-17	7-OMe	
III-18	4-CH ₂ OMe	
III-19	5-CH ₂ OMe	
III-20	6-CH ₂ OMe	
III-21	7-CH ₂ OMe	126-127



(式中、Aは基-C(=O)-、基-CH(OH)-又はQ[ここでQは前記と同じ意味を示す。]を示し、Xはハロゲン原子を示し、R¹、R²、R³、mは前記と同じ意味を示す。)

【0069】一般式【III】で示されるアニリン誘導体1モルに対し、スルホニルハライド誘導体もしくはスルホン酸誘導体の無水物1～2倍モルを無溶媒、或いは適当な溶媒0.5～5l中、塩基1～2倍モルの存在下で反応させることにより、一般式【IV】で示される目的のスルホンアニリド誘導体を得ることができる。

【0070】ここで溶媒としてはn-ヘキサン等の炭化水素、シクロヘキサン等の環状炭化水素、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、1,4-ジオキサン、テトラヒドロフラン(THF)等のエーテル類、N,N-ジメチルホルムアミド(DMF)等のアミド類、N,N-

ジメチルスルホキシド(DMSO)、スルホラン等の硫黄化合物、キノリン、ピリジン等の芳香族含窒素化合物、N,N-ジエチルアニリン等のアニリン誘導体、酢酸、トリフルオロ酢酸等の有機酸、酢酸エチル等のエステル類、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素、アセトニトリル等のニトリル類、ニトロベンゼン等の芳香族ニトロ化合物類、メタノール、エタノール等のアルコール類、水等を例示できる。

【0071】また、塩基としては、水素化ナトリウム等の金属水素化合物、n-ブチルリチウム等の有機金属化合物、ピリジン、トリエチルアミン等の有機塩基、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸カルシウム等のアルカリ金属またはアルカリ土類金属の炭酸化合物、同水酸化化合物、同炭酸水素化合物、さらにナトリウムメトキシド、カリウム t-ブトキシド等のアルコールの金属塩

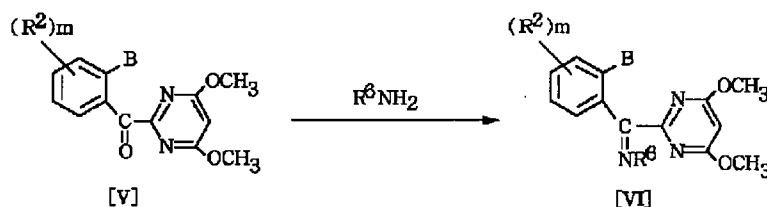
等を例示できる。

【0072】反応温度は -70°C ～ 250°C の温度範囲で行い、好ましくは -20°C から室温の温度範囲であり、反応時間は5分から1週間で終了する。

【0073】＜製造法2＞

【0074】

【化6】



(式中、Bは基 $-\text{NHR}^3$ 、基 $-\text{NR}^3$ (SO_2R^1) 又はニトロ基を示し、m, R^1 , R^2 , R^3 , R^6 は前記と同意味を示す。)

【0075】一般式[V]で示されるカルボニル化合物1モルに対し、 R^6NH_2 で示されるアミン類1～5倍モルを無溶媒又は適当な溶媒(ベンゼン等の芳香族炭化水素類、メタノール等のアルコール類等を例示できる。)0.5～51中で、脱水縮合させる事により、一般式[VI]で示される目的のイミン化合物を得ること

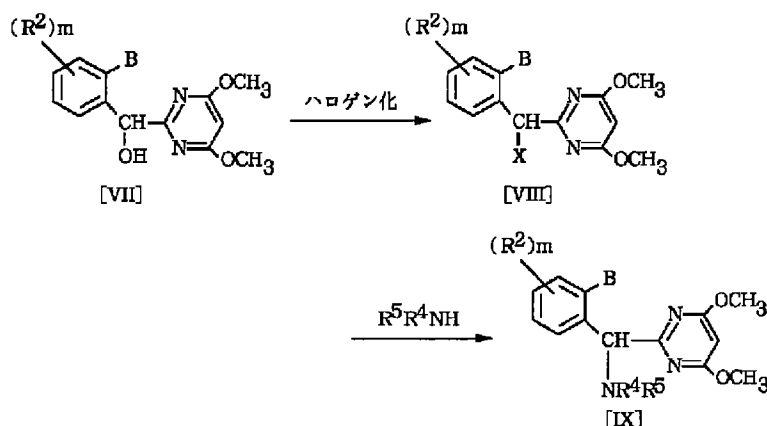
ができる。ここで、場合により適当な触媒(四塩化チタン等のルイス酸類、酢酸カリウム等の塩基類等を例示できる。)0.01～2倍モルを添加しても良い。

【0076】反応温度は -70°C ～ 250°C の温度範囲で行い、好ましくは -20°C から 150°C の温度範囲であり、反応は5分から1週間で終了する。

【0077】＜製造法3＞

【0078】

【化7】



(式中、m, B, R^2 , R^4 , R^5 , Xは前記と同じ意味を示す。)

【0079】一般式[VII]で示される化合物1モルの水酸基を、無溶媒又は適当な溶媒(製造法1に記載と同様である。)0.5～51中で、ハロゲン化剤(塩化チオニル等のハロゲン化硫黄類を例示できる。)1～5倍モルを用いてハロゲン化して一般式[VIII]で示される化合物を得た後、無溶媒又は適当な溶媒(製造法1に記載と同様である。)0.5～51中、一般式 $\text{R}^4\text{R}^5\text{NH}$ で示されるアミン類1～5倍モルと反応させることにより、一般式[IX]で示される目的のアミン化合物を得ることができる。ここで、場合により適当な塩基(水素化ナトリウム等の金属水素化物、n-ブチルリ

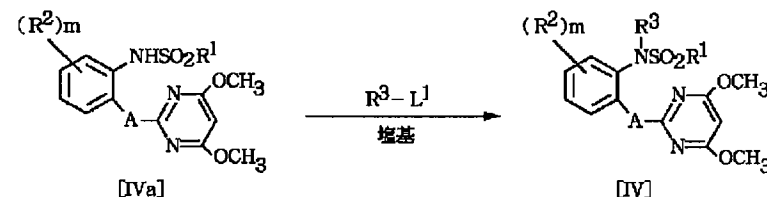
チウム等の有機金属化合物、ピリジン、トリエチルアミン等の有機塩基、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸カルシウム等のアルカリ金属またはアルカリ土類金属の炭酸化合物、同水酸化化合物、同炭酸水素化合物、さらにナトリウムメトキシド、カリウム t-ブトキシド等のアルコールの金属塩等を例示できる。)1～5倍モルを添加しても良い。

【0080】反応温度は -70°C ～ 250°C の温度範囲で行い、好ましくは -20°C から 100°C の温度範囲であり、反応は5分から1週間で終了する。

【0081】＜製造法4＞

【0082】

【化8】



(式中、 L^1 はハロゲン原子、アシルオキシ基、アルキルスルホニルオキシ基、1-イミダゾリル基等の脱離基を示し、 R^1 , R^2 , R^3 , Aは前記と同じ意味を示す。)

【0083】一般式[IVa]で示される化合物(1モル)に対し、一般式 R^3-L^1 で示されるアルキル化剤、アシル化剤又はスルホニル化剤(1~2倍モル)を無溶媒又は適当な溶媒(製造法1に記載と同様である。)0.5~5l中、塩基(水素化ナトリウム等の金属水素化物、*n*-ブチルリチウム等の有機金属化合物、ピリジン、トリエチルアミン等の有機塩基、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸カルシウム等のアルカリ金属またはアルカリ土類金属の炭酸化合物、同水酸化化合物、同炭酸水素化合物、さらにナトリウムメトキシド、カリウム *t*-ブトキシド等のアルコールの金属塩等を例示できる。)1~2倍モルの存在下で反応させることにより、一般式[IV]で示される目的のスルホンアニリド誘導体を得ることができる。

【0084】反応温度は-70℃~250℃の温度範囲で行い、好ましくは-20℃から100℃の温度範囲であり、反応は5分から1週間で終了する。

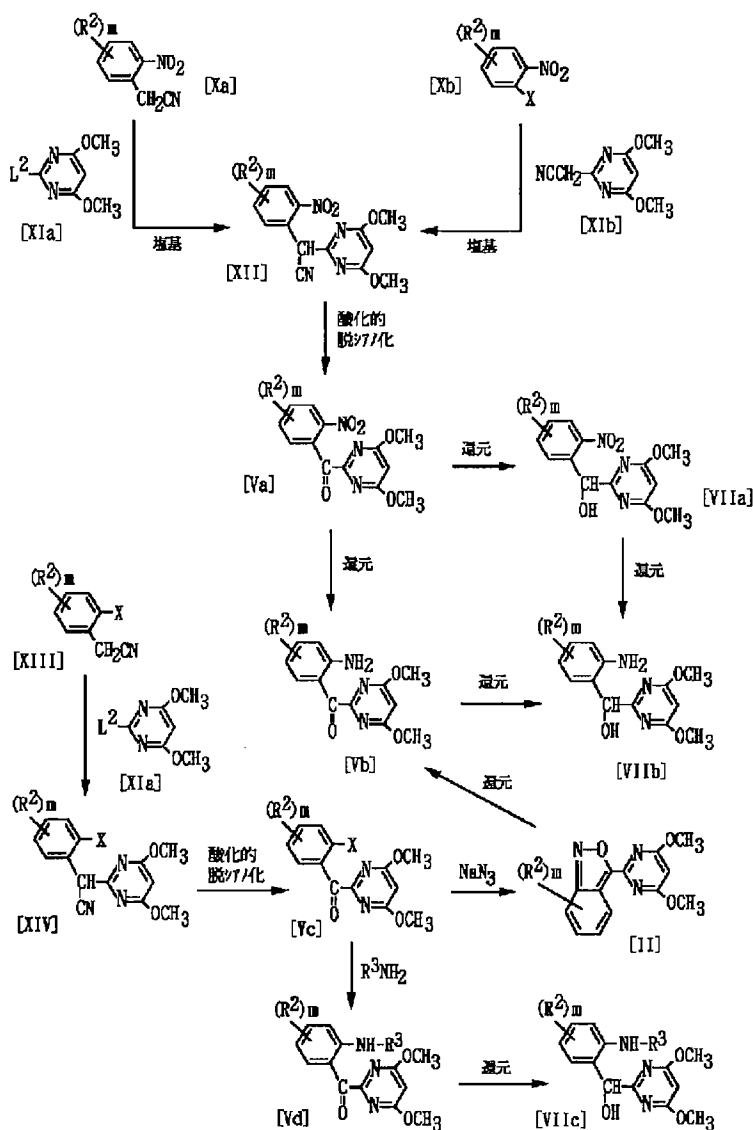
【0085】なお、一般的なスルホンアニリド類の製造法に関しては、前述の特表平7-501053号公報明細書及びWO96/41799号公報明細書に記載があるほか、ジャーナル・オブ・アグリカルチュラル・フード・ケミストリー(J. Agr. Food Chem.)、第22巻(6)、第1111頁(1974年)等に記載がある。

【0086】次に、一般式[II]で示される本発明化合物及び製造法1~4に記載の一般式[III]、

[V]、[VII]で示される中間体の内の幾つかは、例えば化9に示すスキームに従って製造することができるが、これらの方法に限定されるものではない。

【0087】

【化9】



(式中、 L^2 はハロゲン原子又はアルキルスルホニル基等の脱離基を示し、 m 、 R^2 、 R^3 、 X は前記と同じ意味を示す。)

【0088】<製造法5>

一般式 [XII] 及び [XIV] で示される中間体の製造法。

【0089】一般式 [Xa] 又は [XIII] で示されるベンジルシアニド誘導体1モルと、一般式 [XIa] で示されるピリミジン誘導体1~2倍モルとを無溶媒または適当な溶媒(製造法1に記載と同様である。)0.5~5 l中で、適当な塩基(製造法1に記載と同様である。)1~5倍モルの存在下で縮合させることにより、目的の一般式 [XII] 又は [XIV] で示される化合物を得ることができる。

【0090】あるいは、一般式 [Xb] で示されるニトロ化合物1モルと、一般式 [XIb] で示されるピリミジン誘導体1~2倍モルとを無溶媒または適当な溶媒(製造法1に記載と同様である。)0.5~5 l中で、適当な塩基(製造法1に記載と同様である。)1~5倍モルの存在下で縮合させることにより、目的の一般式 [XII] で示される化合物を得ることができる。

【0091】いずれの場合も反応温度は-70℃から250℃の温度範囲で行い、好ましくは-20℃から100℃の温度範囲であり、反応は5分から1週間で終了する。

【0092】<製造法6>

一般式 [Va] 及び [Vc] で示される中間体の製造法。

【0093】一般式 [XII] 又は [XIV] で示されるシアニ化合物1モルを、適当な溶媒(製造法1に記載と同様である。)0.5~5 l中、酸化剤(m -クロロ過安息香酸等の有機過酸類などを例示できる。)1~2倍モルで処理した後、適当な溶媒(水などを例示できる。)0.5~5 l中、適当な塩基(水酸化ナトリウム等のアルカリ金属類などを例示できる。)1~10倍モルと処理することにより酸化的脱シアノ化反応を行い、一般式 [Va] 又は [Vc] で示される目的のカルボニル化合物を得ることができる。

【0094】反応温度は-70℃から溶媒の沸点の温度範囲で行い、好ましくは-20℃から100℃の温度範囲であり、反応は5分から1週間で終了する。

【0095】<製造法7>

一般式 [II] で示される4, 6-ジメトキシピリミジン誘導体の製造法。

【0096】一般式 [Vc] で示されるカルボニル化合物1モルを、適当な溶媒(N, N-ジメチルホルムアミド等のアミド類、N, N-ジメチルスルホキシド(DMSO)、スルホラン等の硫黄化合物などを例示できる。)0.5~5 l中、アジ化ナトリウム等1~5倍モルと処理することにより、一般式 [II] で示される目

的の4, 6-ジメトキシピリミジン誘導体を得ることができる。

【0097】反応温度は-70℃から溶媒の沸点の温度範囲で行い、好ましくは-20℃から150℃の温度範囲であり、反応は5分から1週間で終了する。

【0098】<製造法8>

一般式 [Vb] 及び [VIIb] で示される中間体の製造法。

【0099】一般式 [II] で示される4, 6-ジメトキシピリミジン誘導体あるいは一般式 [Va]、[VIIa] で示されるニトロ化合物1モルを、適当な溶媒(製造法1に記載と同様である。)0.5~5 l中、適当な還元剤(鉄等の金属類などを例示できる。)1~5倍モルで還元することにより、対応する一般式 [Vb] 及び [VIIb] で示される目的のアミノ化合物を得ることができる。場合により触媒として酸(酢酸等の有機酸類などを例示できる。)0.01~1倍モルを添加しても良い。

【0100】或いは、一般式 [II] で示される4, 6-ジメトキシピリミジン誘導体あるいは一般式 [Va]、[VIIa] で示されるニトロ化合物1モルを、適当な溶媒(製造法1に記載と同様である。)0.5~5 l中、触媒(パラジウム等の金属類などを例示できる。)0.01~1倍モルの存在下で、適当な還元剤(ギ酸アンモニウム或いは水素などを例示できる。)1~5倍モルで還元することにより、対応する一般式 [Vb] 及び [VIIb] で示される目的のアミノ化合物を得ることができる。

【0101】いずれの場合も、反応温度は-70℃から溶媒の沸点の温度範囲で行い、好ましくは-20℃から100℃の温度範囲であり、反応は5分から1週間で終了する。

【0102】<製造法9>

一般式 [VIIa]、[VIIb] あるいは [VIIc] で示される中間体の製造法。

【0103】一般式 [Va]、[Vb] あるいは [Vd] で示されるカルボニル化合物1モルを、適当な溶媒(製造法1に記載と同様である。)0.5~5 l中、適当な還元剤(水素化ホウ素ナトリウム等のアルカリ金属水素化錯化合物類などを例示できる。)1~5倍モルで還元することにより、対応する一般式 [VIIa]、[VIIb] あるいは [VIIc] で示される目的のアルコール化合物を得ることができる。

【0104】反応温度は-70℃から溶媒の沸点の温度範囲で行い、好ましくは-20℃から100℃の温度範囲であり、反応は5分から1週間で終了する。

【0105】<製造法10>

一般式 [Vd] で示される中間体の製造法。

【0106】一般式 [Vc] で示される化合物1モルを、無溶媒又は適当な溶媒(製造法1に記載と同様であ

る。) 0.5~5 l 中で、一般式 R^3NH_2 で示されるアミン類 1~5 倍モルと反応させることにより、一般式 [Vd] で示される目的のアミン化合物を得ることができる。

【0107】反応温度は -70℃ から 250℃ の温度範囲で行い、好ましくは -20℃ から 150℃ の温度範囲であり、反応は 5 分から 1 週間で終了する。

【0108】なお、上述の中間体の合成に関しては、ジャーナル・オブ・ケミカル・リサーチ (S) (J. Chem. Research (S)) 第 186 頁 (1977 年)、ヘテロサイクルズ (Heterocycles) 第 38 巻 (1)、第 125 頁 (1994 年) 及び WO 94/08975 号公報明細書等に類似の反応例が記載されている。

【0109】

【実施例】次に、実施例をあげて本発明化合物の製造法、製剤法及び用途を具体的に説明する。尚、本発明化合物の製造中間体の製造法も合わせて記載する。

【0110】<実施例 1>

2'-[1-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-1-(4-モルホリノ)メチル]-1,1-ジフルオロメタンスルホンアニリド (本発明化合物番号 I-296) の製造

【0111】(1) 2-[1-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-1-(4-モルホリノ)メチル] アニリン (化合物 III) の製造

2-[1-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-1-ヒドロキシメチル] アニリン 2.0 g (7.7 ミリモル) をクロロホルム 30 ml に溶解し、0℃ にて攪拌しつつ塩化チオニル 1.0 g (8.4 ミリモル) を滴下した。0℃ から室温にて 30 分攪拌後、室温にてモルホリン 1.4 g (16 ミリモル) を滴下し、室温にて 30 分攪拌した後、さらに加熱還流下 30 分攪拌した。反応液を 5% 塩酸水にて抽出し、抽出液を飽和重曹水で中和後、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶媒、酢酸エチル: n-ヘキサン=1:3) で精製し、淡褐色粘稠液体の 2-[1-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-1-(4-モルホリノ)メチル] アニリン 0.5 g (収率 20%) を得た。

【0112】(2) 2'-[1-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-1-(4-モルホリノ)メチル]-1,1-ジフルオロメタンスルホンアニリド (本発明化合物番号 I-296) の製造

2-[1-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-1-(4-モルホリノ)メチル] アニリン 0.5 g (1.5 ミリモル)、ピリジン 0.3 g (3.8 ミリモル) をクロロホルム 15 ml に溶解し、室温にて攪拌しながら 1,1-ジフルオロメタンスルホン酸クロリド

0.6 g (4.0 ミリモル) を滴下した。室温にて 3 時間攪拌を続けた後、反応液を氷水中にかけ、クロロホルムで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶媒、酢酸エチル: n-ヘキサン=1:3) で精製し、白色粉末 (融点: 143~144℃) の 2'-[1-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-1-(4-モルホリノ)メチル]-1,1-ジフルオロメタンスルホンアニリド 0.3 g (収率 45%) を得た。

【0113】<実施例 2>

2'-[1-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-1-(メトキシイミノ)メチル]-1,1,1-トリフルオロメタンスルホンアニリド (本発明化合物番号 I-55) の製造

【0114】(1) 2'-[1-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルカルボニル)-1,1,1-トリフルオロメタンスルホンアニリド (化合物 V) の製造

2-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルカルボニル) アニリン 3.0 g (11.6 ミリモル)、トリエチルアミン 1.5 g (14.8 ミリモル) をジクロロメタン 50 ml に溶解し、0℃ にて攪拌しながら 1,1,1-トリフルオロメタンスルホン酸無水物 3.9 g (13.8 ミリモル) を約 10 分間で滴下し、そのまま 1 時間攪拌を続けた。反応液を氷水中にかけ 5% 水酸化ナトリウム水溶液 (20 ml) で 2 回抽出し、水層を集め、10% 塩酸で酸性とした後、酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、析出した粗結晶をジソプロピルエーテルで洗浄し、黄土色粉末 (融点: 102~104℃) の 2'-[1-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルカルボニル)-1,1,1-トリフルオロメタンスルホンアニリド 3.0 g (収率 69%) を得た。

【0115】(2) 2'-[1-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-1-(メトキシイミノ)メチル]-1,1,1-トリフルオロメタンスルホンアニリド (本発明化合物番号 I-55) の製造

2'-[1-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルカルボニル)-1,1,1-トリフルオロメタンスルホンアニリド 3.0 g (7.7 ミリモル)、酢酸カリウム 4.0 g (40.8 ミリモル) 及びメトキシアミン塩酸塩 4.0 g (47.9 ミリモル) をエタノール 50 ml に懸濁させ、加熱還流下に攪拌した。反応液を氷水中にかけ酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (溶出溶媒、酢酸エチル: n-ヘキサン=1:3) で精製し、白色結晶 (融点: 89~91℃) の 2'-[1-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-1-

(メトキシイミノ)メチル]-1, 1, 1-トリフルオロメタンスルホンアニリド0.9g(収率28%)を得た。

【0116】<実施例3>

2'-[1-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-1-(エチルアミノ)メチル]-6'-メトキシメチル-1, 1-ジフルオロメタンスルホンアニリド(本発明化合物番号I-359)の製造

【0117】(1) 2'-[1-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-1-ヒドロキシメチル]-6'-メトキシメチル-1, 1-ジフルオロメタンスルホンアニリド(化合物VII)の製造

2-[1-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-1-ヒドロキシメチル]-6-メトキシメチルアニリン4.0g(13.1ミリモル)及びピリジン2.0g(25.3ミリモル)をジクロロメタン30mlに溶解させ、室温にて攪拌しながら1, 1-ジフルオロメタンスルホン酸クロリド3.6g(23.9ミリモル)を滴下した。室温にて7日間攪拌を続けた後、反応液を氷水中にかけ、ジクロロメタンで抽出した。有機層を5%塩酸水、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を減圧留去した。残査をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶媒、酢酸エチル:n-ヘキサン=1:3)で精製し、無色粒状結晶(融点76~77℃)の2'-[1-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-1-ヒドロキシメチル]-6'-メトキシメチル-1, 1-ジフルオロメタンスルホンアニリド2.0g(収率36%)を得た。

【0118】(2) 2'-[1-クロロ-1-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)メチル]-6'-メトキシメチル-1, 1-ジフルオロメタンスルホンアニリド(化合物VIII)の製造

2'-[1-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-1-ヒドロキシメチル]-6'-メトキシメチル-1, 1-ジフルオロメタンスルホンアニリド2.0g(4.8ミリモル)及び塩化チオニル0.7g(5.9ミリモル)をクロロホルム15mlに溶解させ、室温にて2時間攪拌を続けた。溶媒及び過剰の塩化チオニルを減圧留去し、残査をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶媒、酢酸エチル:n-ヘキサン=1:3)で精製し、淡黄色結晶(融点88~89℃)の2'-[1-クロロ-1-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)メチル]-6'-メトキシメチル-1, 1-ジフルオロメタンスルホンアニリド2.0g(収率95%)を得た。

【0119】(3) 2'-[1-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-1-(エチルアミノ)メチル]-6'-メトキシメチル-1, 1-ジフルオロメタンスルホンアニリド(本発明化合物番号I-359)の製造

2'-[1-クロロ-1-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)メチル]-6'-メトキシメチル-1, 1-ジフルオロメタンスルホンアニリド1.0g(2.3ミリモル)をテトラヒドロフラン10mlに溶解させ、室温にて攪拌しながらエチルアミン0.3g(6.7ミリモル)を滴下した。室温にて1時間攪拌を続けた後、溶媒を減圧留去した。残査をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶媒、酢酸エチル:n-ヘキサン=1:1)で精製し、淡赤色粉末(融点188~189℃)の2'-[1-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-1-(エチルアミノ)メチル]-6'-メトキシメチル-1, 1-ジフルオロメタンスルホンアニリド0.9g(収率88%)を得た。

【0120】<実施例4>

N-メトキシメチル-2'-[1-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-1-(ジエチルアミノ)メチル]-1, 1-ジフルオロメタンスルホンアニリド(本発明化合物番号I-256)の製造

2'-[1-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-1-(ジエチルアミノ)メチル]-1, 1-ジフルオロメタンスルホンアニリド0.8g(1.9ミリモル)及び炭酸カリウム1.0g(7.2ミリモル)をN, N-ジメチルホルムアミド15mlに懸濁させ、室温にて攪拌しながらクロロメチルメチルエーテル0.5g(6.2ミリモル)を滴下した。室温にて3時間攪拌を続けた後、反応液を氷水中にかけ、酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を減圧留去した。残査をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶媒、酢酸エチル:n-ヘキサン=1:5)で精製し、無色結晶(融点67~69℃)のN-メトキシメチル-2'-[1-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-1-(ジエチルアミノ)メチル]-1, 1-ジフルオロメタンスルホンアニリド0.8g(収率91%)を得た。

【0121】<実施例5>

3-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-4-フルオロ-2, 1-ベンゾイソオキサゾール(本発明化合物番号II-2)の製造

2-(2, 6-ジフルオロベンゾイル)-4, 6-ジメトキシピリミジン4.0g(14.3ミリモル)およびアジ化ナトリウム1.1g(16.9ミリモル)をN, N-ジメチルホルムアミド30mlに溶解させ、120℃で3時間攪拌した。反応液を室温に戻して氷水中にかけ、酢酸エチルで抽出し、有機層を飽和食塩水にて洗浄後、乾燥した。溶媒を減圧留去し、結晶残査をジイソプロピルエーテルにて洗浄して赤色粉末(融点145~147℃)の3-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-4-フルオロ-2, 1-ベンゾイソオキサゾール1.8g(収率46%)を得た。

【0122】(中間体の製造例)

<参考例1>

(1) 2-(2-ニトロフェニル)-2-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)アセトニトリル(化合物XII)の製造

2-(2-ニトロフェニル)アセトニトリル50g(0.31モル)を500mlのN,N-ジメチルホルムアミドに溶解し、60%水素化ナトリウム24.7g(0.62モル)を添加し、室温にて2時間攪拌した。次に2-メチルスルホニル-4, 6-ジメトキシピリミジン67.7g(0.31モル)を加え、80℃で1時間攪拌した。反応液を水にあげ、10%塩酸水で中和した後、酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を減圧留去した。残査をエタノールより結晶化し、白色粉末(融点88~89℃)の2-(2-ニトロフェニル)-2-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)アセトニトリル73.3g(収率79%)を得た。

【0123】(2) 2-(2, 6-ジフルオロフェニル)-2-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)アセトニトリル(化合物XIV)の製造

2-(2, 6-ジフルオロフェニル)アセトニトリル12g(78ミリモル)を100mlのN,N-ジメチルホルムアミドに溶解し、60%水素化ナトリウム6.3g(0.16モル)を添加し、室温にて2時間攪拌した。次に2-メチルスルホニル-4, 6-ジメトキシピリミジン17g(78ミリモル)を加え、80℃で1時間攪拌した。反応液を水にあげ、10%塩酸水で中和した後、酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を減圧留去した。残査をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶媒、酢酸エチル:n-ヘキサン=1:3)で精製し、無色アメ状物質の2-(2, 6-ジフルオロフェニル)-2-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)アセトニトリル19g(収率83%)を得た。

【0124】(3) 2-(4-フルオロ-2-ニトロフェニル)-2-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)アセトニトリル(化合物XII)の製造

60%水素化ナトリウム11.2g(0.28モル)をN,N-ジメチルホルムアミド100mlに懸濁させ氷水浴で10℃以下に冷却し、攪拌しながら2-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)アセトニトリル25g(0.14モル)のN,N-ジメチルホルムアミド100ml溶液を滴下した。滴下終了後、室温にて水素の発生がなくなるまで攪拌した。再び氷水浴中で10℃以下に冷却し攪拌しながら、2, 5-ジフルオロニトロベンゼン22g(0.14モル)のN,N-ジメチルホルムアミド100ml溶液を滴下した。室温にて12時間攪拌後、反応液を氷水にあげ10%塩酸水で酸性にした後、酢酸エチルで抽出した。有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を減圧

留去した。析出した粗結晶をエタノール/イソプロピルエーテル混合溶媒で洗浄し、無色粒状結晶(融点111~112℃)の2-(4-フルオロ-2-ニトロフェニル)-2-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)アセトニトリル42g(収率94%)を得た。

【0125】同様に(1)及び(3)の方法で以下に示す化合物(化合物XII)を得た。

2-(3-メチル-2-ニトロフェニル)-2-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)アセトニトリル: 淡赤色粒状結晶(融点108~110℃)

2-(3-エチル-2-ニトロフェニル)-2-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)アセトニトリル: 茶褐色粉末(融点113~114℃)

2-(3-メトキシメチル-2-ニトロフェニル)-2-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)アセトニトリル: 赤褐色粉末(融点112~113℃)

【0126】<参考例2>

(1) 5-フルオロ-2-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イルカルボニル)ニトロベンゼン(化合物Va)の製造

2-(4-フルオロ-2-ニトロフェニル)-2-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)アセトニトリル3.2g(10ミリモル)、m-クロロ過安息香酸(50%)6.0g(17ミリモル)をクロロホルム30mlに溶解させ、室温にて12時間攪拌した。ついで10%水酸化ナトリウム水溶液15mlを加え室温にて1時間攪拌した後、クロロホルム50mlを加え抽出した。有機層を5%塩酸水、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を減圧留去した。残査をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶媒、酢酸エチル:n-ヘキサン=1:5)で精製し、白色粒状結晶(融点187~189℃)の5-フルオロ-2-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イルカルボニル)ニトロベンゼン2.7g(収率88%)を得た。

【0127】(2) 2-(2, 6-ジフルオロベンゾイル)-4, 6-ジメトキシピリミジン(化合物Vc)の製造

2-(2, 6-ジフルオロフェニル)-2-(4, 6-ジメトキシピリミジン-2-イル)アセトニトリル19g(65ミリモル)、m-クロロ過安息香酸(50%)30g(87ミリモル)をクロロホルム150mlに溶解させ、加熱還流下6時間攪拌した。ついで室温に戻し10%水酸化ナトリウム水溶液15mlを加え室温にて2時間攪拌した後、クロロホルム50mlを加え抽出した。有機層を5%塩酸水、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥後、溶媒を減圧留去した。残査をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(溶出溶媒、酢酸エチル:n-ヘキサン=1:3)で精製し、白色結晶(融点104~105℃)の2-(2, 6-ジフルオロベンゾイル)-4, 6-ジメトキシピリミジン13g

(収率71%)を得た。

【0128】同様の方法で以下に示す化合物(化合物V a)を得た。

2-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルカルボニル)ニトロベンゼン:淡褐色結晶(融点164~165℃)

6-フルオロ-2-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルカルボニル)ニトロベンゼン:淡褐色粒状結晶(融点181~183℃)

6-メチル-2-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルカルボニル)ニトロベンゼン:無色粒状結晶(融点166~171℃)

6-エチル-2-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルカルボニル)ニトロベンゼン:白色粉末(融点116~117℃)

6-メトキシメチル-2-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルカルボニル)ニトロベンゼン:白色粉末(融点111~113℃)

【0129】<参考例3>

(1)5-フルオロ-2-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルカルボニル)アニリン(化合物V b)の製造

5-フルオロ-2-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルカルボニル)ニトロベンゼン3.1g(10ミリモル)、鉄粉3g(54ミリモル)、水20ml、酢酸エチル150ml及び酢酸1mlの混合物を加熱還流下5時間撹拌した。反応液中の不溶物をろ過助剤を用いて除去し、有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、析出した粗結晶をジイソプロピルエーテルで洗浄し、淡黄色粒状結晶(融点177~179℃)の5-フルオロ-2-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルカルボニル)アニリン2.4g(収率87%)を得た。

【0130】(2)3-フルオロ-2-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルカルボニル)アニリン(化合物V b)の製造

3-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)-4-フルオロ-2,1-ベンゾイソキサゾール1.2g(4.4ミリモル)、パラジウム炭素0.1g及びギ酸アンモニウム0.8g(12.7ミリモル)をメタノール100mlに懸濁させ加熱還流下1時間撹拌した。反応液中の不溶物をろ別し、メタノールを減圧留去後100mlの水を加え酢酸エチルで抽出し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧留去し、析出した粗結晶をジイソプロピルエーテルで洗浄し、黄色粒状結晶(融点129~130℃)の3-フルオロ-2-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルカルボニル)アニリン1.1g(収率91%)を得た。

【0131】同様に(1)の方法で以下に示す化合物(化合物V b)を得た。

2-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルカルボニル)アニリン:黄色結晶(融点166~167℃)

6-フルオロ-2-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルカルボニル)アニリン:黄色粒状結晶(融点131~134℃)

6-メチル-2-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルカルボニル)アニリン:黄色粒状結晶(融点130~132℃)

6-エチル-2-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルカルボニル)アニリン:黄色粉末(融点122~123℃)

6-メトキシメチル-2-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルカルボニル)アニリン:蛍光黄色結晶(融点100~101℃)

【0132】<参考例4>

1-(2-アミノ-4-フルオロフェニル)-1-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)メタノール(化合物VII b)の製造

5-フルオロ-2-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イルカルボニル)アニリン1.1g(4.0ミリモル)をテトラヒドロフラン:水=1:1の混合溶媒50mlに溶解させ、室温で撹拌しながら水素化ホウ素ナトリウム0.3g(7.9ミリモル)を加え、さらに2時間室温で撹拌を続けた。氷水50mlを加え、酢酸エチルで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄後、無水硫酸マグネシウム乾燥した。溶媒を減圧留去し、析出した粗結晶をジイソプロピルエーテルで洗浄し、無色粒状結晶(融点94~95℃)の1-(2-アミノ-4-フルオロフェニル)-1-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)メタノール1.0g(収率90%)を得た。

【0133】同様の方法で以下に示す化合物(化合物VII b)を得た。

1-(2-アミノフェニル)-1-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)メタノール:白色粉末(融点78~80℃)

1-(2-アミノ-3-フルオロフェニル)-1-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)メタノール:無色粒状結晶(融点92~94℃)

1-(2-アミノ-6-フルオロフェニル)-1-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)メタノール:白色粉末(融点109~110℃)

1-(2-アミノ-3-メチルフェニル)-1-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)メタノール:無色粒状結晶(融点109~112℃)

1-(2-アミノ-3-エチルフェニル)-1-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)メタノール:白色結晶(融点85~86℃)

1-(2-アミノ-3-メトキシメチルフェニル)-1-(4,6-ジメトキシピリミジン-2-イル)メタノール

ール：白色結晶（融点40～42℃）

【0134】本発明の除草剤は、一般式〔I〕で示されるスルホンアニリド誘導体を有効成分としてなる。

【0135】本発明化合物を除草剤として使用するには本発明化合物それ自体で用いてもよいが、製剤化に一般的に用いられる担体、界面活性剤、分散剤又は補助剤等を配合して、粉剤、水和剤、乳剤、微粒剤又は粒剤等に製剤して使用することもできる。

【0136】製剤化に際して用いられる担体としては、例えばタルク、ベントナイト、クレイ、カオリン、珪藻土、ホワイカーボン、バーミキュライト、炭酸カルシウム、消石灰、珪砂、硫酸、尿素等の固体担体、イソプロピルアルコール、キシレン、シクロヘキサン、メチルナフタレン等の液体担体等があげられる。

【0137】界面活性剤又は分散剤としては、例えばアルキルベンゼンスルホン酸金属塩、ジナフチルメタジスルホン酸金属塩、アルキル硫酸エステル塩、アルキルアリールスルホン酸塩ホルマリン縮合物、リグニンスルホン酸塩、ポリオキシエチレングリコールエーテル、ポリオキシエチレンアルキルアリールエーテル、ポリオキシエチレンソルビタンモノアルキレート等があげられる。

【0138】補助剤としては、例えばカルボキシメチルセルロース、ポリエチレングリコール、アラビアゴム等があげられる。

【0139】使用に際しては適当な濃度に希釈して散布するか又は直接施用する。

【0140】本発明の除草剤は茎葉散布、土壌施用又は水面施用等により使用することができる。有効成分の配合割合については必要に応じて適宜選ばれるが、粉剤又は粒剤とする場合は0.01～10%（重量）、好ましくは0.05～5%（重量）の範囲から適宜選ぶのがよい。また、乳剤及び水和剤とする場合は1～50%（重量）、好ましくは5～30%（重量）の範囲から適宜選ぶのがよい。

【0141】本発明の除草剤の施用量は使用される化合物の種類、対象雑草、発生傾向、環境条件ならびに使用する剤型等によってかわるが、粉剤又は粒剤のようにそのまま使用する場合は、有効成分として10アール当たり0.1g～5kg、好ましくは1g～1kgの範囲から適宜選ぶのがよい。また、乳剤又は水和剤のように液状で使用する場合は、0.1～50,000ppm、好ましくは10～10,000ppmの範囲から適宜選ぶのがよい。

【0142】また、本発明化合物は必要に応じて殺虫剤、殺菌剤、他の除草剤、植物生長調節剤、肥料等と混用してもよい。

【0143】次に代表的な製剤例をあげて製剤方法を具体的に説明する。化合物、添加剤の種類及び配合比率は、これのみに限定されることなく広い範囲で変更可能

である。以下の説明において「部」は重量部を意味する。

【0144】〈製剤例1〉 水和剤

化合物（I-253）の10部にポリオキシエチレンオクチルフェニルエーテルの0.5部、β-ナフタレンスルホン酸ホルマリン縮合物ナトリウム塩の0.5部、珪藻土の20部、クレイの69部を混合粉砕し、水和剤を得る。

【0145】〈製剤例2〉 水和剤

化合物（I-353）の10部にポリオキシエチレンオクチルフェニルエーテルの0.5部、β-ナフタレンスルホン酸ホルマリン縮合物ナトリウム塩の0.5部、珪藻土の20部、ホワイカーボンの5部、クレイの64部を混合粉砕し、水和剤を得る。

【0146】〈製剤例3〉 水和剤

化合物（I-367）の10部にポリオキシエチレンオクチルフェニルエーテルの0.5部、β-ナフタレンスルホン酸ホルマリン縮合物ナトリウム塩の0.5部、珪藻土の20部、ホワイカーボンの5部、炭酸カルシウムの64部を混合粉砕し、水和剤を得る。

【0147】〈製剤例4〉 乳剤

化合物（I-335）の30部にキシレンとイソホロンの等量混合物60部、界面活性剤ポリオキシエチレンソルビタンアルキレート、ポリオキシエチレンアルキルアリールポリマー及びアルキルアリールスルホネートの混合物の10部を加え、これらをよくかきまぜることによって乳剤を得る。

【0148】〈製剤例5〉 粒剤

化合物（I-269）の10部、タルクとベントナイトを1：3の割合で混合した増量剤の80部、ホワイカーボンの5部、界面活性剤ポリオキシエチレンソルビタンアルキレート、ポリオキシエチレンアルキルアリールポリマー及びアルキルアリールスルホネートの混合物の5部に水10部を加え、よく練ってペースト状としたものを直径0.7mmのふるい穴から押し出して乾燥した後、0.5～1mmの長さに切断し、粒剤を得る。

【0149】次に試験例をあげて本発明化合物の奏する効果を説明する。

【0150】〈試験例1〉 水田湛水処理による除草効果試験

100cm²のプラスチックポットに水田土壌を充填し、代掻後、タイヌビエ（Ec）、コナギ（Mo）及びホタルイ（Sc）の各種子を播種し、水深3cmに湛水した。翌日、製剤例1に準じて調製した水和剤を水で希釈し、水面に滴下処理した。施用量は、有効成分を10アール当たり100gとした。その後、温室内で育成し、処理後28日目に表36の基準に従って除草効果を調査した。結果を表37～表43に示す。

【0151】

【表36】

指数	除草効果（生育抑制程度）及び薬害
5	無処理区に対し90%以上の抑制の除草効果、薬害
4	無処理区に対し70%以上90%未満の除草効果、薬害
3	無処理区に対し50%以上70%未満の除草効果、薬害
2	無処理区に対し30%以上50%未満の除草効果、薬害
1	無処理区に対し10%以上30%未満の除草効果、薬害
0	無処理区に対し 0%以上10%未満の除草効果、薬害

【0152】

【表37】

化合物番号	除 草 効 果		
	E c	M o	S c
I - 1	5	5	5
I - 2	5	5	5
I - 3	5	5	5
I - 4	5	5	5
I - 7	5	5	5
I - 253	5	5	5
I - 256	3	5	5
I - 257	5	5	5
I - 258	5	5	5
I - 259	5	5	5
I - 260	5	5	5
I - 261	5	5	5
I - 262	5	5	5
I - 263	5	5	5
I - 264	5	5	5
I - 265	5	5	5
I - 266	5	5	5
I - 267	5	5	5
I - 268	5	5	5
I - 269	5	5	5
I - 270	5	5	5
I - 271	5	5	5
I - 272	5	5	5
I - 273	5	5	5
I - 274	5	5	5
I - 275	5	5	5
I - 276	5	5	5
I - 277	5	5	5
I - 278	5	5	5

化合物番号	除 草 効 果		
	E c	M o	S c
I - 279	4	5	5
I - 280	5	5	5
I - 281	5	5	5
I - 282	5	5	5
I - 283	5	5	5
I - 284	5	5	5
I - 285	5	5	5
I - 286	5	5	5
I - 287	5	5	5
I - 288	5	5	5
I - 289	5	5	5
I - 290	5	5	5
I - 291	5	5	5
I - 292	5	5	5
I - 293	5	5	5
I - 294	5	5	5
I - 295	4	5	5
I - 296	5	5	5
I - 297	5	5	5
I - 298	5	5	5
I - 299	5	5	5
I - 300	5	5	5
I - 301	4	5	5
I - 302	5	5	5
I - 303	5	5	5
I - 304	5	5	5
I - 305	5	5	5
I - 306	5	5	5
I - 307	5	5	5

【0154】

【表39】

【0153】

【表38】

化合物番号	除 草 効 果		
	E c	M o	S c
I-308	5	5	5
I-309	5	5	5
I-310	5	5	5
I-311	5	5	5
I-312	5	5	5
I-313	4	5	5
I-314	5	5	5
I-315	5	5	5
I-316	5	5	5
I-317	5	5	5
I-318	5	5	5
I-319	5	5	5
I-320	5	5	5
I-321	5	5	5
I-322	4	5	5
I-323	5	5	5
I-324	5	5	5
I-325	5	5	5
I-326	5	5	5
I-327	5	5	5
I-328	5	5	5
I-329	4	5	5
I-330	5	5	5
I-331	5	5	5
I-332	5	5	5
I-333	5	5	5
I-334	5	5	5
I-335	5	5	5
I-336	5	5	5

【0155】

【表40】

化合物番号	除 草 効 果		
	E c	M o	S c
I-337	5	5	5
I-338	5	5	5
I-339	5	5	5
I-340	5	5	5
I-341	5	5	5
I-342	5	5	5
I-343	5	5	5
I-344	5	5	5
I-345	5	5	5
I-346	5	5	5
I-347	5	5	5
I-348	5	5	5
I-349	5	5	5
I-350	5	5	5
I-351	5	5	5
I-352	5	5	5
I-353	5	5	5
I-354	5	5	5
I-355	5	5	5
I-356	5	5	5
I-357	5	5	5
I-358	5	5	5
I-359	5	5	5
I-360	5	5	5
I-361	5	5	5
I-362	5	5	5
I-363	5	5	5
I-364	5	5	5
I-365	5	5	5

【0156】

【表41】

化合物番号	除 草 効 果		
	E c	M o	S c
I-366	5	5	5
I-367	5	5	5
I-368	5	5	5
I-369	5	5	5
I-370	5	5	5
I-371	5	5	5
I-372	5	5	5
I-492	5	5	5
I-493	5	5	5
I-494	5	5	5
I-495	5	5	5
I-496	5	5	5
I-498	5	5	5
I-499	5	5	5
I-500	5	5	5
I-501	5	5	5
I-502	5	5	5
I-503	5	5	5
I-504	5	5	5
I-505	5	5	5
I-506	4	5	5
I-507	5	5	5
I-508	5	5	5
I-509	5	5	5
I-510	5	5	5
I-511	5	5	5
I-512	5	5	5
I-513	5	5	5
I-514	5	5	5

【0157】

【表42】

化合物番号	除 草 効 果		
	E c	M o	S c
I-515	2	5	5
I-516	5	5	5
I-517	5	5	5
I-521	5	5	5
I-522	5	5	5
I-523	5	5	5
I-524	5	5	5
I-525	5	5	5
I-526	5	5	5
I-527	5	5	5
I-528	5	5	5
I-529	5	5	5
I-530	5	5	5
I-531	5	5	5
I-532	5	5	5
I-533	5	5	5
I-534	5	5	5
I-535	4	5	5
I-536	5	5	5
I-537	5	5	5
I-538	5	5	5
I-539	5	5	5
I-540	5	5	5
I-541	5	5	5
I-542	5	5	5
I-543	5	5	5
I-544	5	5	5
I-545	5	5	5
I-546	5	5	5

【0158】

【表43】

化合物番号	除 草 効 果		
	E c	M o	S c
I-547	4	5	5
I-548	5	5	5
I-549	5	5	5
I-550	5	5	5
I-551	5	5	5
I-552	5	5	5
I-553	5	5	5
I-554	5	5	5
I-555	5	5	5
I-556	5	5	5
I-557	5	5	5
I-558	5	5	5
I-559	4	5	5
I-560	5	5	5
I-561	5	5	5
I-562	5	5	5
I-563	5	5	5
I-564	5	5	5
I-565	5	5	5
I-566	5	5	5
I-567	5	5	5
I-568	5	5	5
II-45	5	5	5
II-55	4	5	5
II-56	4	5	5
II-57	5	5	5

【0159】〈試験例2〉 水田湛水処理による作物選択性試験

100cm²のプラスチックポットに水田土壌を充填し、代掻後、コナギ(Mo)およびホタルイ(Sc)の各種子を0.5cmの深さに播種し、さらに2葉期の水稻(Or)を移植深度2cmで2本移植し、水深3cmに湛水した。翌日、製剤例1に準じて調製した水和剤の所定有効成分量(ai, g/10a)を水で希釈し、水面に滴下処理した。その後、温室内で育成し、処理後28日目に表36の基準に従って除草効果および薬害程度を調査した。結果を表44～表49に示す。

【0160】

【表44】

化合物 番 号	薬量 a i, g /10 a	除 草 効 果		薬 害 O r
		M o	S c	
I-1	1.6	5	4	0
I-4	1.6	5	4	0
I-7	1.6	5	4	0
I-253	1.6	5	5	0
I-257	1.6	5	5	0
I-258	6.3	5	5	0
I-259	1.6	5	—	0
I-260	6.3	5	5	0
I-262	6.3	5	5	0
I-263	6.3	5	5	0
I-264	25	5	5	0
I-265	1.6	5	5	0
I-266	1.6	5	—	0
I-268	1.6	5	5	0
I-269	0.4	5	5	0
I-271	1.6	5	—	0
I-272	1.6	—	5	0
I-273	1.6	5	5	0
I-274	1.6	5	—	0
I-275	1.6	5	5	0
I-276	1.6	5	5	0
I-278	1.6	5	5	0
I-280	1.6	—	5	0
I-281	1.6	—	5	0
I-282	1.6	5	5	0
I-283	1.6	—	5	0
I-285	1.6	—	5	0
I-286	6.3	—	5	0

【0161】

【表45】

化合物 番 号	薬量 a i, g /10 a	除 草 効 果		薬 害 O r
		M o	S c	
I-287	1.6	—	5	0
I-288	1.6	5	5	0
I-289	1.6	—	5	0
I-290	1.6	—	5	0
I-291	1.6	—	5	0
I-293	1.6	5	5	0
I-294	6.3	5	5	0
I-295	25	—	5	0
I-298	6.3	5	5	0
I-299	1.6	5	5	0
I-300	6.3	5	5	0
I-301	1.6	—	5	0
I-302	1.6	5	5	0
I-303	6.3	5	5	0
I-304	6.3	5	5	0
I-305	6.3	5	5	0
I-306	25	5	5	0
I-307	6.3	5	5	0
I-309	6.3	5	5	0
I-311	6.3	5	5	0
I-312	1.6	5	5	0
I-313	6.3	5	5	0
I-314	6.3	5	5	0
I-315	1.6	5	5	0
I-316	1.6	—	5	0
I-321	1.6	5	5	0
I-324	1.6	5	5	0
I-325	6.3	5	5	0
I-326	25	5	5	0

【0162】

【表46】

化合物 番 号	薬量 a i, g /10 a	除 草 効 果		薬 害 O r
		M o	S c	
I-328	1.6	5	5	0
I-329	1.6	-	5	0
I-330	6.3	5	5	0
I-331	6.3	5	5	0
I-332	25	5	5	0
I-333	25	5	5	0
I-334	25	5	5	0
I-335	25	5	5	0
I-337	1.6	5	4	0
I-338	1.6	5	3	0
I-339	6.3	5	5	1
I-343	6.3	5	5	0
I-344	1.6	5	5	0
I-346	6.3	5	4	0
I-347	1.6	5	4	0
I-348	1.6	5	5	0
I-349	1.6	5	4	0
I-352	25	5	5	0
I-353	25	4	5	0
I-354	6.3	5	5	0
I-355	6.3	5	5	0
I-356	25	5	5	0
I-357	25	5	5	0
I-358	25	4	5	0
I-359	25	5	5	0
I-360	100	5	5	1
I-361	25	5	5	1
I-362	100	5	5	1
I-363	100	5	5	0

【0163】

【表47】

化合物 番 号	薬量 a i, g /10 a	除 草 効 果		薬 害 O r
		M o	S c	
I-364	100	5	5	0
I-365	6.3	5	5	0
I-366	25	5	5	0
I-367	25	5	5	0
I-368	100	5	5	1
I-370	100	5	5	1
I-371	100	5	5	1
I-372	100	5	5	0
I-493	6.3	5	5	0
I-494	6.3	—	5	0
I-495	6.3	5	5	0
I-496	1.6	5	5	0
I-498	6.3	5	5	0
I-499	25	5	5	0
I-500	25	5	5	0
I-501	6.3	5	5	0
I-502	25	5	5	0
I-503	6.3	5	5	0
I-504	25	5	5	0
I-505	6.3	5	5	0
I-506	6.3	5	5	0
I-507	25	5	5	0
I-508	1.6	5	5	0
I-509	25	5	5	0
I-510	25	5	5	0
I-511	6.3	5	5	0
I-512	25	5	5	0
I-513	6.3	5	5	0
I-514	6.3	5	5	0

【0164】

【表48】

化合物 番 号	薬量 a i, g /10 a	除 草 効 果		薬 害 O r
		M o	S c	
I-515	100	5	5	0
I-516	6.3	5	5	0
I-517	6.3	5	5	0
I-521	25	5	5	0
I-522	25	5	5	0
I-523	1.6	5	5	0
I-524	6.3	4	5	0
I-525	6.3	5	5	0
I-526	25	5	5	0
I-527	6.3	5	5	0
I-528	25	5	5	0
I-529	25	5	5	0
I-530	6.3	5	5	0
I-531	25	5	5	0
I-532	100	5	5	0
I-533	6.3	5	5	0
I-534	25	5	5	0
I-535	100	5	5	0
I-536	25	5	5	0
I-537	25	5	5	0
I-538	6.3	5	5	0
I-539	25	5	5	0
I-540	6.3	5	5	0
I-541	25	5	5	0
I-542	25	5	5	0
I-543	6.3	5	5	0
I-544	6.3	5	5	0
I-546	6.3	5	5	0
I-550	1.6	4	5	0

【0165】

【表49】

化合物 番 号	薬量 a i, g / 10 a	除 草 効 果		薬 害 O r
		M o	S c	
I-551	25	5	5	0
I-552	100	5	5	0
I-553	6.3	5	5	0
I-554	25	5	5	0
I-556	25	5	5	0
I-557	6.3	5	5	0
I-558	6.3	5	5	0
I-559	100	5	5	0
I-560	6.3	5	5	0
I-561	1.6	5	5	0
I-562	25	5	5	0
I-563	6.3	5	5	0
I-564	6.3	5	5	0
I-565	100	5	5	0
I-566	25	5	5	0
I-567	100	5	5	0
I-568	1.6	5	5	0
II-55	25	5	5	0
II-56	100	5	5	0
II-57	25	5	5	0

【0166】

【発明の効果】一般式〔I〕で表される本発明の化合物は、水田に発生するタイヌビエ、タマガヤツリ、コナギ、アゼナ等の一年生雑草及びヘラオモダカ、ホタルイ、ウリカワ、オモダカ、ミズガヤツリ、クログワイ等

の多年生雑草に対し、発生前から生育期の広い範囲にわたって、雑草の発生および生育を長期間抑制し、低薬量で防除することができる。一方、同時にイネに対して高い安全性を有するものである。

フロントページの続き

(51)Int. Cl.⁶

C 0 7 D 403/06

413/04

識別記号

2 3 3

2 3 9

F I

C 0 7 D 403/06

413/04

2 3 3

2 3 9

(72)発明者 鈴木 千治

静岡県磐田郡福田町塩新田408番地の1

株式会社ケイ・アイ研究所内

(72)発明者 中谷 昌央

静岡県磐田郡福田町塩新田408番地の1

株式会社ケイ・アイ研究所内

(72)発明者 田丸 雅敏

静岡県磐田郡福田町塩新田408番地の1

株式会社ケイ・アイ研究所内

(72)発明者 小野 至正

静岡県静岡市敷地2丁目13番地の10

(72)発明者 井田 智久

静岡県小笠郡菊川町町加茂3353番地

(72)発明者 柳沢 克忠

静岡県小笠郡菊川町半済3061番地の88

(72)発明者 佐土原 英雄

埼玉県新座市堀ノ内2丁目9番地の3